



PCT

特許協力条約に基づいて公開された国際出願

<p>(51) 国際特許分類7 A61K 31/13, 31/445, 31/454, 31/4709, 31/55, 31/553, 31/4523, 31/4525, 31/4535, 31/473, 31/437, C07D 211/32, 401/06, 413/06, 405/06, 409/06, 471/06, 219/10, 221/18, 491/107</p>	<p>A1</p>	<p>(11) 国際公開番号 WO00/18391</p> <p>(43) 国際公開日 2000年4月6日 (06.04.00)</p>
<p>(21) 国際出願番号 PCT/JP99/05367</p> <p>(22) 国際出願日 1999年9月30日 (30.09.99)</p> <p>(30) 優先権データ 特願平10/276677 1998年9月30日 (30.09.98) JP</p> <p>(71) 出願人 (米国を除くすべての指定国について) 武田薬品工業株式会社 (TAKEDA CHEMICAL INDUSTRIES, LTD.)[JP/JP] 〒541-0045 大阪府大阪市中央区道修町四丁目1番1号 Osaka, (JP)</p> <p>(72) 発明者 ; および</p> <p>(75) 発明者 / 出願人 (米国についてののみ) 石原雄二 (ISHIHARA, Yuji)[JP/JP] 〒664-0874 兵庫県伊丹市山田3丁目3番8号 Hyogo, (JP) 土居孝行 (DOI, Takayuki)[JP/JP] 〒594-0013 大阪府和泉市鶴山台1丁目10番25号 Osaka, (JP) 長袋 洋 (NAGABUKURO, Hiroshi)[JP/JP] 〒533-0003 大阪府大阪市東淀川区南江口1丁目3番25-603 Osaka, (JP) 石地雄二 (ISHICHI, Yuji)[JP/JP] 〒567-0867 大阪府茨木市大正町1丁目1-210 Osaka, (JP)</p>		<p>(74) 代理人 弁理士 朝日奈忠夫, 外 (ASAHINA, Tadao et al.) 〒532-0024 大阪府大阪市淀川区十三本町2丁目17番85号 武田薬品工業株式会社 大阪工場内 Osaka, (JP)</p> <p>(81) 指定国 AE, AL, AM, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, CA, CN, CR, CU, CZ, DM, EE, GD, GE, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KG, KR, KZ, LC, LK, LR, LT, LV, MD, MG, MK, MN, MX, NO, NZ, PL, RO, RU, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TR, TT, TZ, UA, US, UZ, VN, YU, ZA, 欧州特許 (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE), OAPI特許 (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG), ARIPO特 許 (GH, GM, KE, LS, MW, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZW), ユーラシ ア特許 (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM)</p> <p>添付公開書類 国際調査報告書</p>
<p>(54) Title: DRUGS FOR IMPROVING VESICAL EXCRETORY STRENGTH</p> <p>(54) 発明の名称 膀胱排出力改善剤</p> <p>(57) Abstract Drugs for improving vesical excretory strength which contain a non-carbamate amine compound having an acetylcholinesterase inhibitory effect.</p>		

アセチルコリンエステラーゼ阻害作用を有する非カルバメート系アミン化合物を含有してなる膀胱排出力改善剤。

PCTに基づいて公開される国際出願のパンフレット第一頁に掲載されたPCT加盟国を同定するために使用されるコード(参考情報)

AE	アラブ首長国連邦	DM	ドミニカ	KZ	カザフスタン	RU	ロシア
AL	アルバニア	EE	エストニア	LC	セントルシア	SD	スーダン
AM	アルメニア	ES	スペイン	LI	リヒテンシュタイン	SE	スウェーデン
AT	オーストリア	FI	フィンランド	LK	スリ・ランカ	SG	シンガポール
AU	オーストラリア	FR	フランス	LR	リベリア	SI	スロヴェニア
AZ	アゼルバイジャン	GA	ガボン	LS	レソト	SK	スロヴァキア
BA	ボスニア・ヘルツェゴビナ	GB	英国	LT	リトアニア	SL	シエラ・レオネ
BB	バルバドス	GD	グレナダ	LU	ルクセンブルグ	SN	セネガル
BE	ベルギー	GE	グルジア	LV	ラトヴィア	SZ	スワジランド
BF	ブルキナ・ファソ	GH	ガーナ	MA	モロッコ	TD	チャード
BG	ブルガリア	GM	ガンビア	MC	モナコ	TG	トーゴ
BJ	ベナン	GN	ギニア	MD	モルドヴァ	TJ	タジキスタン
BR	ブラジル	GW	ギニア・ビサオ	MG	マダガスカル	TZ	タンザニア
BY	ベラルーシ	GR	ギリシャ	MK	マケドニア旧ユーゴスラヴィア共和国	TM	トルクメニスタン
CA	カナダ	HR	クロアチア	ML	マリ	TR	トルコ
CF	中央アフリカ	HU	ハンガリー	MN	モンゴル	TT	トリニダード・トバゴ
CG	コンゴ	ID	インドネシア	MR	モーリタニア	UA	ウクライナ
CH	スイス	IE	アイルランド	MW	マラウイ	UG	ウガンダ
CI	コートジボアール	IL	イスラエル	MX	メキシコ	US	米国
CM	カメルーン	IN	インド	NE	ニジェール	UZ	ウズベキスタン
CN	中国	IS	アイスランド	NL	オランダ	VN	ヴェトナム
CR	コスタ・リカ	IT	イタリア	NO	ノールウェー	YU	ユーゴスラビア
CU	キューバ	JP	日本	NZ	ニュージーランド	ZA	南アフリカ共和国
CY	キプロス	KE	ケニア	PL	ポーランド	ZW	ジンバブエ
CZ	チェコ	KG	キルギスタン	PT	ポルトガル		
DE	ドイツ	KP	北朝鮮	RO	ルーマニア		
DK	デンマーク	KR	韓国				

明細書

膀胱排出力改善剤

技術分野

- 5 本発明は、医薬、より詳しくは膀胱排出力改善剤に関する。

背景技術

- 10 下部尿路疾患は、尿の蓄積（蓄尿）から排泄（排尿）の過程における自覚的あるいは他覚的異常の総称であり、蓄尿障害（尿失禁、頻尿等）、排尿障害（排尿困難、排尿痛、尿路閉塞等）等に分けられる。下部尿路疾患は、若年層からも見受けられるが、近年、高齢化社会の進展とともに、高齢者の下部尿路疾患、特に排尿障害、とりわけ前立腺肥大症に伴う排尿困難が大きな社会問題となっている。

- 15 排尿は、排尿中枢の支配下、骨盤神経等の副交感神経、下腹神経等の交感神経及び陰部神経等の体性神経からなる末梢神経系が司っており、種々の神経伝達物質（例えば、アセチルコリン、アドレナリン、ATP、サブスタンスP、ニューロペプチドY等）の関与が示唆されている。

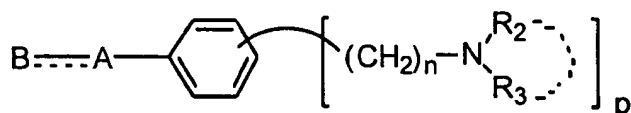
- 20 排尿障害、特に排尿困難の治療薬としては、膀胱筋（排尿筋）の収縮力を増強させる薬剤、又は、尿道筋を弛緩し、尿道抵抗を減弱させる薬剤が用いられる。膀胱筋に働き、その収縮力を増強させる薬剤としては、例えばベサネコール等のコリン作用剤、ジスチグミン等のアセチルコリンエステラーゼ阻害剤等が使用されているが、例えば、ベサネコールには、流涙、発汗、胃腸障害、腹痛等の副作用があり、妊婦、消化性潰瘍、器質的腸管閉塞、喘息、甲状腺機能亢進症等には禁忌であり、今だ満足な薬剤は見い出されていない。

- 25 また、膀胱筋収縮力の増強作用を有するアセチルコリンエステラーゼ阻害剤としては、分子内にカルバメート構造（-OCON-）を有するカルバメート系アセチルコリンエステラーゼ阻害剤（例えば、ジスチグミン、ネオスチグミン等）が知られている。該カルバメート系アセチルコリンエステラーゼ阻害剤は、その分子構造上の特徴であるカルバメート構造に基づいて阻害作用を発現
30 することが知られている（Goodman & Gilman's The PHARMACOLOGICAL BASIS OF

THERAPEUTICS, Ninth ed., McGraw-Hill, New York, p.161-176)。しかしながら、例えば、ジスチグミンは膀胱筋を収縮させる一方で、尿道筋を収縮し、尿道抵抗をあげる作用を有しており、そのために排尿効率が悪く、臨床での効果が不十分であることが知られている。また、ネオスチグミンは、作用持続が短いため治療には用いられない（「神経因性膀胱の診断と治療」第2版、服部孝道、安田耕作著、医学書院 p105-106, p139）。

一方、アセチルコリンエステラーゼ阻害作用を有し、カルバメート系阻害剤とは構造の異なる種々のアミン化合物が以下のように報告されている。

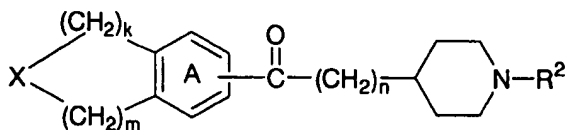
①EP-A-0 3 7 8 2 0 7に記載の下式化合物又はその塩。



〔式中、Bは置換されていてもよい飽和又は不飽和の5～7員アザ複素環状基を示し、Aは結合手又は炭化水素残基、オキソ基若しくはヒドロキシ基で置換されていてもよいアルキレン基又はアルケニレン基を示し、 \cdots は単結合若しくは二重結合を示し（但し、Aが結合手を表すときは、 \cdots は単結合を表す）、 R_2 及び R_3 はそれぞれ独立して水素原子若しくは置換基を有していてもよい炭化水素残基を示すか（但し、同時に水素原子ではない）又は、隣接する窒素原子とともに環状アミノ基を形成してもよく、nは0、1又は2を示し、pは1又は2を示す。〕

具体例として、3-[1-(フェニルメチル)ピペリジン-4-イル]-1-[4-(ピロリジン-1-イル)フェニル]-1-プロパノン、1-[4-(N,N-ジメチルアミノ)フェニル]-3-[1-(フェニルメチル)ピペリジン-4-イル]-1-プロパノン等が記載されている。

②特開平5-140149号公報に記載の下式化合物又はその塩。

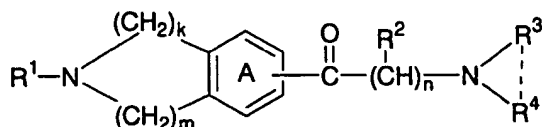


〔式中、Xは $\text{R}^1\text{---N}<$ （ R^1 は水素原子、置換基を有していてもよい炭化水素基又は置換基を有していてもよいアシル基を示す）、酸素原子又は硫黄原子

を示し、 R^2 は水素原子又は置換基を有していてもよい炭化水素基を示し、環Aは置換基を有していてもよいベンゼン環を、 k は0～3の整数を、 m は1～8の整数を、 n は1～6の整数を示す。]

具体例として、3-[1-(フェニルメチル)ピペリジン-4-イル]-1-(2, 3-ジヒドロ-1H-インドール-5-イル)-1-プロパノン、3-[1-(フェニルメチル)ピペリジン-4-イル]-1-(2, 3, 4, 5-テトラヒドロ-1H-1-ベンズアゼピン-8-イル)-1-プロパノン等が記載されている。

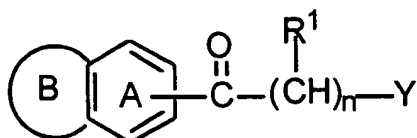
③特開平6-166676号公報に記載の下式化合物又はその塩。



〔式中、 R^1 は水素原子、置換基を有していてもよい炭化水素基又は置換基を有していてもよいアシル基を示し、A環は更に置換基を有していてもよいベンゼン環を示し、 n は1ないし10の整数を示し、 R^2 、 R^3 及び R^4 は同一又は異なって水素原子又は置換基を有していてもよい炭化水素基を示し、あるいは R^3 と R^4 は隣接する窒素原子と共に置換基を有していてもよい複素環基を形成していてもよく、 R^2 は n の繰返しにおいてそれぞれ異なっていてもよく、 k は0ないし3の整数を、 m は1ないし8の整数を示す。但し、 $k=0$ かつ $m=2$ の時、 $n>1$ である。〕

具体例として、1-[3-(フェニルメチル)-2, 3, 4, 5-テトラヒドロ-1H-3-ベンズアゼピン-7-イル]-3-[4-(フェニルメチル)ピペラジン-1-イル]-1-プロパノン、1-[2-(フェニルメチル)-2, 3, 4, 5-テトラヒドロ-1H-2-ベンズアゼピン-8-イル]-3-[4-(フェニルメチル)ピペラジン-1-イル]-1-プロパノン等が記載されている。

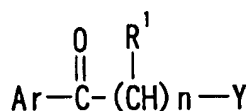
④特開平6-206875号公報に記載の下式化合物又はその塩。



- 〔式中、A環は更に置換基を有していてもベンゼン環を、B環は同一又は異なるヘテロ原子を2個以上含む非芳香性複素環であって、置換基を有していてもよく、R¹は水素原子又は置換基を有していてもよい炭化水素基であって、nの繰返しにおいて異なってもよく、Yは置換基されていてもよいアミノ基又は置換基されていてもよい含窒素飽和複素環基を、nは1ないし10の整数を示す。〕

具体例として、3-[1-(フェニルメチル)ピペリジン-4-イル]-1-(2,3,4,5-テトラヒドロ-1,4-ベンズオキサゼピン-7-イル)-1-プロパノン等が記載されている。

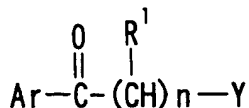
- ⑤特開平7-206854号には、式



- 〔式中、Arは少なくとも一つの複素環が縮合した三環式縮合ベンゼン環基であって、置換基を有していてもよく、nは2ないし10の整数を示し、R¹は水素原子又は置換基を有していてもよい炭化水素基であって、nの繰返しにおいて異なってもよく、Yはそれぞれ置換基を有していてもよい4-ピペリジニル基、1-ピペラジニル基又は4-ベンジルー1-ピペリジニル基を示す。〕

- 具体例としては、8-[3-[1-(フェニルメチル)-4-ピペリジニル]-1-オキソプロピル]-1,2,5,6-テトラヒドロ-4H-ピロロ[3,2,1-ij]キノリン-4-オン、1-(1,2,2a,3,4,5-ヘキサヒドロベンズ[c,d]インドール-6-イル)-3-[1-(フェニルメチル)-4-ピペリジニル]-1-プロパノン等が記載されている。

⑥特開平7-309835号公報に記載の下式化合物又はその塩。



- 〔式中、Arは置換基を有していてもよい四環式縮合複素環基を示し、nは1ないし10の整数を示し、R¹は水素原子又は置換基を有していてもよい炭化水素基であって、nの繰返しにおいて異なってもよく、Yはそれぞれ置

換基を有していてもよいアミノ基又は含窒素飽和複素環基を示す。]

具体例として、3-[3-[1-(フェニルメチル)-4-ピペリジニル]-1-オキソプロピル]-7, 11b, 12, 13-テトラヒドロ-5H-イソインドロ[2, 1-b][2]ベンズアゼピン-7-オン、2-[1-オキソ-3-[1-(フェニルメチル)-4-ピペリジニル]]-4, 5, 7a, 8, 9, 10, 11, 11a-オクタヒドロ-6H-ピリド[3, 2, 1-jk]カルバゾール-6-オン等が記載されている。

⑦WO 93/07140、特表平6-500794号、特開平4-234845号、特開平6-116237号、特開平7-109275号、WO 97/37992、特開平5-148228号、特開平5-194359号、特開平6-507387号、特表平7-502272号、特表平8-511515号、特開平6-41070号、特開平5-9188号、特開平5-279355号、特開平5-320160号、特開平6-41125号、特開平5-345772号、特開平7-502529号、特開昭64-79151号、特開昭62-234065号、特開平4-235161号、特開平4-21670号、特開平9-268176号等に記載のアミン化合物。

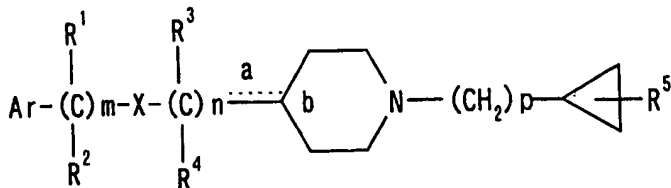
⑧特開平2-167267号、特開昭63-166881号、特開平2-96580号、特開平3-153667号、特開昭61-148154号、特公平5-41141号、特開昭63-284175号、特開平3-95161号、特開平3-220189号、特開平4-134083号、特開平4-66571号、特表平11-500144号、特表平10-511651号、特開平4-290872号、特開平2-231421号、特開平4-18071号、特開平4-159225号、特開平4-346975号、WO 99/11625、J. Am. Chem. Soc., 1991, 113, p4695-4696、J. Am. Chem. Soc., 1989, 111, p4116-4117、WO 97/11077、Heterocycles, 1977, 8, p277-282、J. Chem. Soc. (C), 1971, p1043-1047等に記載のアミン化合物。

⑨特開平2-91052号、特開平3-95143号、特開平3-141244号、特開平3-223251号、特開平5-239024号、特開平2-138255号等に記載のアミン化合物。

また、種々の薬理作用を有するアミン化合物が以下のように報告されている

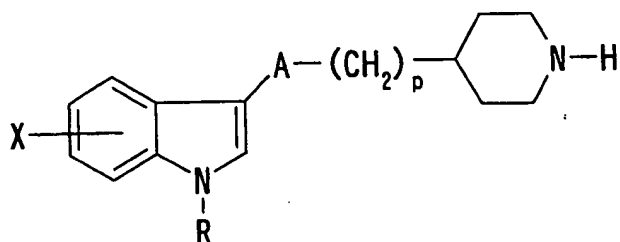
。

① WO 91/03243には、抗精神薬として用いられる式



- [式中、mは0ないし3を、nは0ないし3を示し、m、nが共に0を示すことはなく、pは0ないし3を、Xは、O、S、SO、SO₂、NR⁶、CR⁷R⁸、CO又はCHOHを、R¹、R³及びR⁷はそれぞれ水素原子、C₁₋₅アルキル、ハロゲン、NR¹⁰R¹¹、OH、COOH、C₂₋₆カルボアルコキシ、CN、Ar、C₁₋₅アルコキシ又はC₁₋₅アルキルチオを示し、R²、R⁴及びR⁸はそれぞれ水素原子、C₁₋₅アルキル、C₂₋₆カルボアルコキシ、CN、C₁₋₅アルコキシ又はAr¹を示し、XがO、S、SO、SO₂又はNR⁶のとき、R¹、R²、R³及びR⁴はC₁₋₅アルコキシ、C₁₋₅アルキルチオ、NR¹⁰R¹¹又はOHではなく、R⁵は水素原子、アルキル、ハロゲン、OH又はアルケニルを、R⁶は水素原子、C₁₋₅アルキル又はAr¹を、Ar及びAr¹はそれぞれナフチル、ピリジル、ピリミジル、インドリル、キノリニル、イソキノリニル又はフェニル基を示し、これらの基はC₁₋₃アルキル、C₁₋₃アルコキシ、1ないし7のハロゲン原子を有するC₁₋₃ハロアルキル、SH、S(O)_t-C₁₋₃アルキル(tは1、2又は3)、C₂₋₆ジアルキルアミノ、ハロゲン、C₁₋₃アルキルアミノ、NH₂、CN、NO₂、SO₃H、テトラゾール、COOH、C₂₋₆カルボアルコキシ、CONH₂、SO₂、NO₂、COR⁹、CONR¹²R¹³、SO₂NR¹²R¹³、Ar²、OAr²又はSAr²で置換されていてもよい。Ar²はナフチル又はフェニル基であり、これらの基はC₁₋₃アルキル、1ないし7のハロゲン原子を有するC₁₋₃ハロアルキル、C₁₋₃アルコキシ、ハロゲン又はC₁₋₃アルキルチオで置換されていてもよい。R⁹、R¹⁰、R¹¹、R¹²及びR¹³はそれぞれ水素原子、C₁₋₅アルキル又はフェニルを示し、R¹⁰とR¹¹は共にC₃₋₆アルキレン鎖を、R¹²とR¹³は共にC₃₋₆アルキレン鎖を形成してもよい。a又はbは二重結合又は単結合を示し、共に二重結合を示すことはない。]で表される化合物又はその薬理的に許容できる塩が記載されている。

②特開昭52-72829号には、特にセロトニン系機能障害によって生ずる病気の治療に使用される、式



〔式中、Rは水素原子、炭素原子1ないし4個を含有するアルキル基又はアルキル部分が炭素原子1若しくは2個含有するアラルキル基を表し、Xは水素原子又はハロゲン原子、それぞれが炭素原子1ないし4個を有することができるアルキル、アルコキシ、又はアルキルチオ基、トリフルオロメチル、ニトロ、ヒドロキシ又は置換されていないアミノ基又は1個若しくは2個のアルキル基又はアシル又はアルキルスルホニル基で置換されているアミノ基を表し、Aは基 $-CO-$ 又は基 $-CH_2-$ を表し、nは0、1又は2である。〕で表される化合物又はその塩が記載されている。

しかしながら、排尿障害（排尿困難）の予防・治療剤としての作用、膀胱排出力改善剤としての作用については、今まで何ら報告も示唆も開示もされていない。

膀胱排出力改善作用を有することが知られている公知の化合物に比べて、排尿効率が高く、汎用性の高い、排尿障害、特に排尿困難の予防・治療剤の開発が望まれている。

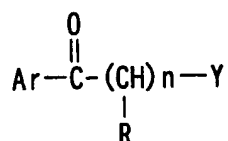
発明の開示

本発明者らは、この様な現状に鑑み、排尿効率が低い新しい膀胱排出力改善剤、排尿障害、特に排尿困難の治療薬の探索研究を進め、鋭意検討した結果、アセチルコリンエステラーゼ阻害作用を有する非カルバメート系アミン化合物が、予想外にも優れた膀胱筋収縮増強作用を示すと共に、尿道筋収縮作用を有しない、予想外にも優れた膀胱排出力改善作用、排尿障害、特に排尿困難の予防・治療作用等を有していることを見出し、これに基づいて本発明を完成した。即ち、本発明は、

(1) アセチルコリンエステラーゼ阻害作用を有する非カルバメート系アミン

化合物を含有してなる膀胱排出力改善剤、

(2) アミン化合物が、式



〔式中、Arは縮合していてもよいフェニル基で、該フェニル基は置換基を有
5 していてもよい、

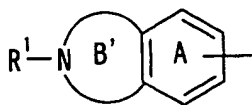
nは1ないし10の整数、

Rは水素原子又は置換基を有していてもよい炭化水素基、

Yは置換基を有していてもよいアミノ基又は置換基を有していてもよい含窒素
飽和複素環基を示す。〕で表される非カルバメート系化合物又はその塩である

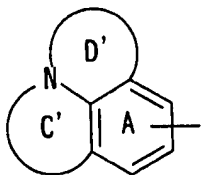
10 前記(1)記載の剤、

(3) Arが式



〔式中、R¹は水素原子、置換基を有していてもよい炭化水素基、アシル基又
は置換基を有していてもよい複素環基、A環は置換基を有していてもよいベン
15 ゼン環、B'環は更にオキソ基で置換されていてもよい5ないし9員の含窒素複
素環を示す。〕で表される基である前記(2)記載の剤、

(4) Arが式

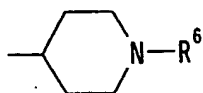


〔式中、A環は置換基を有していてもよいベンゼン環、C'環及びD'環は、そ
20 れぞれ更にオキソ基で置換されていてもよい5ないし9員の含窒素複素環を示
す。〕で表される基である前記(2)記載の剤、

(5) nが2である前記(2)記載の剤、

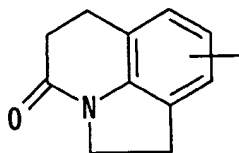
(6) Rが水素原子である前記(2)記載の剤、

(7) Yが式



〔式中、 R^6 は水素原子、置換基を有していてもよい炭化水素基、アシル基又は置換基を有していてもよい複素環基を示す。〕で表される基である前記（2）記載の剤、

5 (8) Arが式

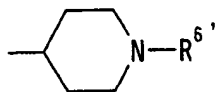


で表される基；

nが2；

Rが水素原子；及び

10 Yが式



〔式中、 $R^{6'}$ はハロゲン原子、 C_{1-3} アルキル、 C_{1-3} アルコキシ、シアノ、ニトロ及びヒドロキシから選ばれる置換基を1又は2個有していてもよいベンジルを示す。〕で表される基である前記（2）記載の剤、

15 (9) 8-[3-[1-[(3-フルオロフェニル)メチル]-4-ピペリジニル]-1-オキソプロピル]-1,2,5,6-テトラヒドロ-4H-ピロロ[3,2,1-ij]キノリン-4-オン、

8-[3-[1-(フェニルメチル)-4-ピペリジニル]-1-オキソプロピル]-1,2,5,6-テトラヒドロ-4H-ピロロ[3,2,1-ij]キノリ

20 ン-4-オン、

8-[3-[1-[(2-ヒドロキシフェニル)メチル]-4-ピペリジニル]-1-オキソプロピル]-1,2,5,6-テトラヒドロ-4H-ピロロ[3,2,1-ij]キノリン-4-オン、又はその塩を含有してなる前記（1）記載の剤、

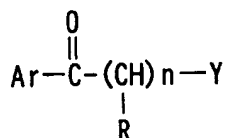
25 (10) 排尿障害予防治療剤である前記（1）記載の剤、

(11) 排尿困難予防治療剤である前記（1）記載の剤、及び

(12) アセチルコリンエステラーゼ阻害作用を有する非カルバメート系アミン化合物と α -遮断剤とを組合わせることを特徴とする膀胱排出力改善剤等に関する。

本発明で用いられる「アセチルコリンエステラーゼ阻害作用を有する非カルバメート系アミン化合物」は、アセチルコリンエステラーゼ阻害作用を有し、分子内にカルバメート構造(—OCON—)を有さず、アンモニアの水素原子を炭化水素基で置換した化合物であればよく、好ましくは、第一級アミン化合物、第二級アミン化合物、第三級アミン化合物である。更に好ましくは、以下に記載する化合物等が列記される。これらの化合物のうち、少なくとも1個の5ないし7員含窒素複素環を部分構造として有する化合物等が好ましく、中でも後述の1)、20)、23)、41)、42)及び43)の化合物等が好ましく、1)の化合物等が特に好ましい。

1) 式



[式中、Arは縮合していてもよいフェニル基で、該フェニル基は置換基を有していてもよい、
nは1ないし10の整数、
Rは水素原子又は置換基を有していてもよい炭化水素基、
Yは置換基を有していてもよいアミノ基又は置換基を有していてもよい含窒素飽和複素環基を示す。]で表される化合物(以下、化合物(I)と略記することもある)又はその塩。

上記式中、Arで示される「縮合していてもよいフェニル基で、該フェニル基は置換基を有していてもよい」の「置換基」としては、例えば、(i)ハロゲン化されていてもよい低級アルキル基、(ii)ハロゲン原子(例えば、フルオロ、クロル、ブロム、ヨード等)、(iii)低級アルキレンジオキシ基(例えば、メチレンジオキシ、エチレンジオキシ等のC₁₋₃アルキレンジオキシ基等)、(iv)ニトロ基、(v)シアノ基、(vi)ヒドロキシ基、(vii)ハロゲン化されていてもよい低級アルコキシ基、(viii)シクロアルキル基(例えば、シ

- クロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル等の C_{3-6} シクロアルキル基等)、(ix)ハロゲン化されていてもよい低級アルキルチオ基、(x)アミノ基、(xi)モノー低級アルキルアミノ基(例えば、メチルアミノ、エチルアミノ、プロピルアミノ等のモノー C_{1-6} アルキルアミノ基等)、(xii)ジー低級アルキルアミノ基(例えば、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ等のジー C_{1-6} アルキルアミノ基等)、(xiii)5ないし7員環状アミノ基(例えば、1個の窒素原子以外に窒素原子、酸素原子及び硫黄原子等から選ばれるヘテロ原子を1ないし3個有していてもよい5ないし7員環状アミノ基(例、ピロリジノ、ピペリジノ、ピペラジノ、モルホリノ、チオモルホリノ等)等)、(xiv)低級アルキル-カルボニルアミノ基(例えば、アセチルアミノ、プロピオニルアミノ、ブチリルアミノ等の C_{1-6} アルキル-カルボニルアミノ基等)、(xv)低級アルキルスルホニルアミノ基(例えば、メチルスルホニルアミノ、エチルスルホニルアミノ、プロピルスルホニルアミノ等の C_{1-6} アルキルスルホニルアミノ基等)、(xvi)低級アルコキシ-カルボニル基(例えば、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、プロポキシカルボニル、イソブトキシカルボニル等の C_{1-6} アルコキシ-カルボニル基等)、(xvii)カルボキシ基、(xviii)低級アルキル-カルボニル基(例えば、メチルカルボニル、エチルカルボニル、ブチルカルボニル等の C_{1-6} アルキル-カルボニル基等)、(xix)シクロアルキル-カルボニル基(例えば、シクロプロピルカルボニル、シクロブチルカルボニル、シクロペンチルカルボニル、シクロヘキシルカルボニル等の C_{3-6} シクロアルキル-カルボニル基等)、(xx)カルバモイル基、チオカルバモイル基、(xxi)モノー低級アルキル-カルバモイル基(例えば、メチルカルバモイル、エチルカルバモイル、プロピルカルバモイル、ブチルカルバモイル等のモノー C_{1-6} アルキル-カルバモイル基等)、(xxii)ジー低級アルキル-カルバモイル基(例えば、ジエチルカルバモイル、ジブチルカルバモイル等のジー C_{1-6} アルキル-カルバモイル基等)、(xxiii)低級アルキルスルホニル基(例えば、メチルスルホニル、エチルスルホニル、プロピルスルホニル等の C_{1-6} アルキルスルホニル基等)、(xxiv)シクロアルキルスルホニル基(例えば、シクロペンチルスルホニル、シクロヘキシルスルホニル等の C_{3-6} シクロアルキルスルホニル等)、(xxv)フェニル基、(xxvi)ナフチル基

- 、(xxvii) モノフェニル低級アルキル基（例えばベンジル、フェニルエチル等のモノフェニル- C_{1-6} アルキル基等）、(xxviii) ジフェニル低級アルキル基（例えば、ジフェニルメチル、ジフェニルエチル等のジフェニル- C_{1-6} アルキル基等）、(xxix) モノフェニル低級アルキルカルボニルオキシ基（例えばフェニルメチルカルボニルオキシ、フェニルエチルカルボニルオキシ等のモノフェニル- C_{1-6} アルキルカルボニルオキシ基等）、(xxx) ジフェニル低級アルキルカルボニルオキシ基（例えば、ジフェニルメチルカルボニルオキシ、ジフェニルエチルカルボニルオキシ等のジフェニル- C_{1-6} アルキルカルボニルオキシ基等）、(xxxi) フェノキシ基、
- 10 (xxxii) モノフェニル低級アルキルカルボニル基（例えばフェニルメチルカルボニル、フェニルエチルカルボニル等のモノフェニル- C_{1-6} アルキルカルボニル基等）、(xxxiii) ジフェニル低級アルキルカルボニル基（例えば、ジフェニルメチルカルボニル、ジフェニルエチルカルボニル等のジフェニル- C_{1-6} アルキルカルボニル基等）、(xxxiv) ベンゾイル基、
- 15 (xxxv) フェノキシカルボニル基、(xxxvi) フェニル低級アルキルカルバモイル基（例えば、フェニルメチルカルバモイル、フェニルエチルカルバモイル等のフェニル- C_{1-6} アルキルカルバモイル基等）、(xxxvii) フェニルカルバモイル基、(xxxviii) フェニル低級アルキルカルボニルアミノ基（例えば、フェニルメチルカルボニルアミノ、フェニルエチルカルボニルアミノ等のフェニル- C_{1-6} アルキルカルボニルアミノ基等）、(xxxix)
- 20 フェニル低級アルキルアミノ基（例えば、フェニルメチルアミノ、フェニルエチルアミノ等のフェニル- C_{1-6} アルキルアミノ基等）、(xxxx) フェニル低級アルキルスルホニル基（例えば、フェニルメチルスルホニル、フェニルエチルスルホニル等のフェニル- C_{1-6} アルキルスルホニル基等）、
- 25 (xxxxi) フェニルスルホニル基、(xxxxii) フェニル低級アルキルスルフィニル基（例えば、フェニルメチルスルフィニル、フェニルエチルスルフィニル等のフェニル- C_{1-6} アルキルスルフィニル基等）、(xxxxiii) フェニル低級アルキルスルホニルアミノ基（例えば、フェニルメチルスルホニルアミノ、フェニルエチルスルホニルアミノ等のフェニル- C_{1-6} アルキルスルホニルアミノ基等）及び (xxxxiv) フェニルスルホニルアミノ基（前記 (xxv
- 30

5) ないし (xxxxiv) のフェニル基、ナフチル基、モノーフェニルー低級アルキル基、ジーフェニルー低級アルキル基、モノーフェニルー低級アルキルーカルボニルオキシ基、ジーフェニルー低級アルキルーカルボニルオキシ基、フェノキシ基、モノーフェニルー低級アルキルーカルボニル基、ジーフェニルー低級アルキルーカルボニル基、ベンゾイル基、フェノキシカルボニル基、フェニルー低級アルキルーカルバモイル基、フェニルカルバモイル基、フェニルー低級アルキルーカルボニルアミノ基、フェニルー低級アルキルアミノ基、フェニルー低級アルキルスルホニル基、フェニルスルホニル基、フェニルー低級アルキルスルフィニル基、フェニルー低級アルキルスルホニルアミノ基及びフェニルスルホニルアミノ基は、更に、例えば、低級アルキル基（例えば、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、sec-ブチル、tert-ブチル、ペンチル、ヘキシル等のC₁₋₆アルキル等）、低級アルコキシ基（例えば、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ、ブトキシ、イソブトキシ、sec-ブトキシ、tert-ブトキシ等のC₁₋₆アルコキシ等）、ハロゲン原子（例えば、クロル、ブロム、ヨード等）、ヒドロキシ基、ベンジルオキシ基、アミノ基、モノー低級アルキルアミノ基（例えば、メチルアミノ、エチルアミノ、プロピルアミノ等のモノーC₁₋₆アルキルアミノ等）、ジー低級アルキルアミノ基（例えば、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ等のジーC₁₋₆アルキルアミノ等）、ニトロ基、低級アルキルーカルボニル基（例えば、メチルカルボニル、エチルカルボニル、ブチルカルボニル等のC₁₋₆アルキルーカルボニル等）、ベンゾイル基等から選ばれた1ないし4個の置換基を有していてもよい。）等が挙げられる。該フェニル基はこれらの置換基を1ないし4個有していてもよい。

上記の「ハロゲン化されていてもよい低級アルキル基」としては、例えば、1ないし3個のハロゲン原子（例えば、クロル、ブロム、ヨード等）を有していてもよい低級アルキル基（例えば、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、sec-ブチル、tert-ブチル、ペンチル、ヘキシル等のC₁₋₆アルキル基等）等が挙げられ、具体例としては、メチル、クロロメチル、ジフルオロメチル、トリクロロメチル、トリフルオロメチル、エチル、2-ブロモエチル、2, 2, 2-トリフルオロエチル、プロピル、3, 3, 3-トリフルオロプロピル、イソプロピル、ブチル、4, 4, 4-トリフルオロブチル、イソブチ

ル、sec-ブチル、tert-ブチル、ペンチル、イソペンチル、ネオペンチル、5, 5, 5-トリフルオロペンチル、ヘキシル、6, 6, 6-トリフルオロヘキシル等が挙げられる。

上記の「ハロゲン化されていてもよい低級アルコキシ基」としては、例えば、1ないし3個のハロゲン原子（例えば、クロル、ブロム、ヨード等）を有していてもよい低級アルコキシ基（例えば、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ、ブトキシ、イソブトキシ、sec-ブトキシ、tert-ブトキシ等のC₁₋₆アルコキシ基等）等が挙げられ、具体例としては、例えばメトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、エトキシ、2, 2, 2-トリフルオロエトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ、ブトキシ、4, 4, 4-トリフルオロブトキシ、イソブトキシ、sec-ブトキシ、ペンチルオキシ、ヘキシルオキシ等が挙げられる。

上記の「ハロゲン化されていてもよい低級アルキルチオ基」としては、例えば、1ないし3個のハロゲン原子（例えば、クロル、ブロム、ヨード等）を有していてもよい低級アルキルチオ基（例えば、メチルチオ、エチルチオ、プロピルチオ、イソプロピルチオ、ブチルチオ、イソブチルチオ、sec-ブチルチオ、tert-ブチルチオ等のC₁₋₆アルキルチオ基等）等が挙げられ、具体例としては、メチルチオ、ジフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルチオ、エチルチオ、プロピルチオ、イソプロピルチオ、ブチルチオ、4, 4, 4-トリフルオロブチルチオ、イソブチルチオ、sec-ブチルチオ、tert-ブチルチオ、ペンチルチオ、ヘキシルチオ等が挙げられる。

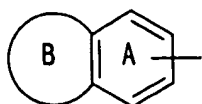
「縮合していてもよいフェニル基で、該フェニル基は置換基を有していてもよい」の「置換基」として好ましくは、(i) アミノ基、(ii) モノ-低級アルキルアミノ基（例えば、メチルアミノ、エチルアミノ、プロピルアミノ等のモノ-C₁₋₆アルキルアミノ基等）、(iii) ジ-低級アルキルアミノ基（例えば、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ等のジ-C₁₋₆アルキルアミノ基等）、(iv) 例えば1個の窒素原子以外に窒素原子、酸素原子及び硫黄原子等から選ばれるヘテロ原子を1ないし3個有していてもよい5ないし7員環状アミノ基（例えば、ピロリジノ、ピペリジノ、ピペラジノ、モルホリノ、チオモルホリノ等）、(v) 低級アルキル-カルボニルアミノ基（例えば、アセチルアミノ、ブ

ロピオニルアミノ、ブチリルアミノ等の C_{1-6} アルキル-カルボニルアミノ基等)、(vi) 低級アルキルスルホニルアミノ基(例えば、メチルスルホニルアミノ、エチルスルホニルアミノ、プロピルスルホニルアミノ等の C_{1-6} アルキルスルホニルアミノ基等)、(vii) フェニル-低級アルキルアミノ(例えば、
 5 フェニル-メチルアミノ、フェニル-エチルアミノ等のフェニル- C_{1-6} アルキルアミノ等)、(viii) フェニル-低級アルキルスルホニルアミノ基(例えば、フェニル-メチルスルホニルアミノ、フェニル-エチルスルホニルアミノ等のフェニル- C_{1-6} アルキル-スルホニルアミノ基等)、(ix) フェニルスルホニルアミノ基、(x) ハロゲン原子(例えば、フルオロ、クロル等)、(xi)
 10) ハロゲン化されていてもよい低級アルキル基(例えば、メチル、エチル、イソプロピル、tert-ブチル、トリフルオロメチル等)及び(xii) ハロゲン化されていてもよい低級アルコキシ基(例えば、メトキシ、エトキシ、イソプロポキシ、tert-ブトキシ、トリフルオロメトキシ等)等が挙げられ、特に、ジ-低級アルキルアミノ基(例えば、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ等のジ- C_{1-6} アルキルアミノ基等)、1個の窒素原子以外に窒素原子、酸素原子及び硫黄
 15 原子等から選ばれるヘテロ原子を1ないし3個有していてもよい5ないし7員環状アミノ基(例えば、ピロリジノ、ピペリジノ、ピペラジノ、モルホリノ、チオモルホリノ等)等が好ましい。

該「縮合していてもよいフェニル基で、該フェニル基は置換基を有していてもよい」の「フェニル基」が縮合する例としては、例えば、

- (1) 置換基を有していてもよい単環式複素環と縮合する場合、
- (2) 置換基を有していてもよい2環式複素環と縮合する、あるいは2つの同一又は異なった単環(但し、少なくとも一方の環が単環式複素環である)と縮合する場合、及び
- 25 (3) 置換基を有していてもよい3環式複素環と縮合する場合等が挙げられる。

上記(1)の「縮合していてもよいフェニル基で、該フェニル基は置換基を有していてもよい」のフェニル基が単環式複素環と縮合する場合の具体例としては、例えば、式



〔式中、A環は置換基を有していてもよいベンゼン環、及びB環は置換基を有していてもよい複素環を示す。〕で表される基等が挙げられる。

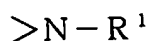
A環の置換基としては、上記の「縮合していてもよいフェニル基で、該フェニル基は置換基を有していてもよい」の「置換基」等が挙げられ、その置換基数は1ないし3個である。

5 B環で示される「置換基を有していてもよい複素環」の「複素環」としては、例えば、窒素原子、酸素原子及び硫黄原子から選ばれるヘテロ原子を1ないし4個含む4ないし14員（好ましくは5ないし9員）芳香族又は非芳香族複素環等が挙げられる。具体的には例えば、ピリジン、ピラジン、ピリミジン、
10 イミダゾール、フラン、チオフェン、ジヒドロピリジン、ジアゼピン、オキサゼピン、ピロリジン、ピペリジン、ヘキサメチレンイミン、ヘプタメチレンイミン、テトラヒドロフラン、ピペラジン、ホモピペラジン、テトラヒドロオキサゼピン、モルホリン、チオモルホリン、ピロール、ピラゾール、1, 2, 3-
15 ートリアゾール、オキサゾール、オキサゾリジン、チアゾール、チアゾリジン、イソオキサゾール、イミダゾリン等が挙げられる。このうち、1個のヘテロ原子あるいは同一又は異なる2個のヘテロ原子を含有する5ないし9員環の非芳香族複素環（例えば、ピロリジン、ピペリジン、ヘキサメチレンイミン、ヘプタメチレンイミン、テトラヒドロフラン、ピペラジン、ホモピペラジン、テトラヒドロオキサゼピン、モルホリン、チオモルホリン等）等が好ましい。特
20 に、①例えば窒素原子、酸素原子及び硫黄原子から選ばれる1個のヘテロ原子を含有する非芳香族複素環、②1個の窒素原子と窒素原子、酸素原子及び硫黄原子から選ばれる1個のヘテロ原子とを含有する非芳香族複素環等が好ましい。

B環で示される「置換基を有していてもよい複素環」の「置換基」としては
25 、例えば (i) ハロゲン原子（例えば、フルオロ、クロル、ブロム、ヨード等）、(ii) ニトロ基、(iii) シアノ基、(iv) オキソ基、(v) ヒドロキシ基、(vi) 低級アルキル基（例えば、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、イソブチル、tert-ブチル、sec-ブチル等のC₁₋₆アルキル基等）(vii) 低級アルコキシ基（例えば、メトキシ、エトキシ、プロピルオキシ、イソプロピルオキシ、ブチルオキシ等のC₁₋₆アルコキシ基等）、(viii) 低級アル
30

- キルチオ基（例えば、メチルチオ、エチルチオ、プロピルチオ等のC₁₋₆アルキルチオ基等）、(ix) アミノ基、(x) モノー低級アルキルアミノ基（例えば、メチルアミノ、エチルアミノ、プロピルアミノ等のモノーC₁₋₆アルキルアミノ基等）、(xi) ジー低級アルキルアミノ基（例えば、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ等のジーC₁₋₆アルキルアミノ基等）、(xii) 例えば炭素原子と1個の窒素原子以外に窒素原子、酸素原子及び硫黄原子等から選ばれるヘテロ原子を1ないし3個有していてもよい5ないし7員環状アミノ基（例えば、ピロリジノ、ピペリジノ、ピペラジノ、モルホリノ、チオモルホリノ等）、(xiii) 低級アルキル-カルボニルアミノ基（例えば、アセチルアミノ、プロピオニルアミノ、ブチリルアミノ等のC₁₋₆アルキル-カルボニルアミノ基等）、(xiv) 低級アルキルスルホニルアミノ基（例えば、メチルスルホニルアミノ、エチルスルホニルアミノ等のC₁₋₆アルキル-カルボニルアミノ基等）、(xv) 低級アルコキシ-カルボニル基（例えば、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、プロポキシカルボニル等のC₁₋₆アルコキシ-カルボニル基等）、(xvi) カルボキシ基、(xvii) 低級アルキルカルボニル基（例えば、メチルカルボニル、エチルカルボニル、プロピルカルボニル等のC₁₋₆アルキル-カルボニル基等）、(xviii) カルバモイル基、(xix) モノー低級アルキルカルバモイル基（例えば、メチルカルバモイル、エチルカルバモイル等のモノーC₁₋₆アルキル-カルバモイル基等）、(xx) ジー低級アルキルカルバモイル基（例えば、ジメチルカルバモイル、ジエチルカルバモイル等のジーC₁₋₆アルキル-カルバモイル基等）、(xxi) 低級アルキルスルホニル基（例えば、メチルスルホニル、エチルスルホニル、プロピルスルホニル等のC₁₋₆アルキルスルホニル基等）等から選ばれた1ないし5個が用いられる。中でも、オキソ基、低級アルキル基（例えば、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、イソブチル、tert-ブチル、sec-ブチル等のC₁₋₆アルキル基等）等が好ましい。特にオキソ基等が好ましい。

B環が環中に窒素原子を有する場合、例えば、B環は環中に式



- 〔式中、R¹は水素原子、置換基を有していてもよい炭化水素基、アシル基又は置換基を有していてもよい複素環基を示す。〕で表される基を有していても

よい。更に、B環は上記置換基 (i) ないし (xxi) を1ないし3個有していてもよい。

R¹で示される「置換基を有していてもよい炭化水素基」の「炭化水素基」は、炭化水素化合物から水素原子を1個除いた基を示し、その例としては、例えば以下のアルキル基、アルケニル基、アルキニル基、シクロアルキル基、アリール基、アラルキル基、これらの組み合わせの基等が挙げられる。このうち、C₁₋₁₆炭化水素基等が好ましい。

- (1) アルキル基 (例えば、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、イソブチル、tert-ブチル、sec-ブチル、ペンチル、ヘキシル等のC₁₋₆アルキル基等)
- (2) アルケニル基 (例えば、ビニル、アリル、イソプロペニル、ブテニル、イソブテニル、sec-ブテニル等のC₂₋₆アルケニル基等)
- (3) アルキニル基 (例えば、プロパルギル、エチニル、ブチニル、1-ヘキシニル等のC₂₋₆アルキニル基等)
- (4) シクロアルキル基 (例えば、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル等のC₃₋₆シクロアルキル基等)
- (5) 架橋環式低級飽和炭化水素基 (例えば、ビスクロ〔3.2.1〕オクト-2-イル、ビスクロ〔3.3.1〕ノン-2-イル、アダマンタン-1-イル等の架橋環式C₈₋₁₄飽和炭化水素基等)
- (6) アリール基 (例えば、フェニル、1-ナフチル、2-ナフチル、ビフェニル、2-インデニル、2-アンスリル等のC₆₋₁₄アリール基等、好ましくはフェニル基等)
- (7) アラルキル基 (例えば、ベンジル、フェニルエチル、フェニルプロピル、フェニルブチル、フェニルペンチル、フェニルヘキシル等のフェニル-C₁₋₁₀アルキル； α -ナフチルメチル等のナフチル-C₁₋₆アルキル；ジフェニルメチル、ジフェニルエチル等のジフェニル-C₁₋₃アルキル等のC₇₋₁₆アラルキル基等)
- (8) アリール-アルケニル基 (例えばスチリル、シンナミル、4-フェニル-2-ブテニル、4-フェニル-3-ブテニル等のフェニル-C₂₋₁₂アルケニル等のC₆₋₁₄アリール-C₂₋₁₂アルケニル基等)

(9) アリール- C_{2-12} アルキニル基（例えば、フェニルエチニル、3-フェニル-2-プロピニル、3-フェニル-1-プロピニル等のフェニル- C_{2-12} アルキニル等の C_{6-14} アリール- C_{2-12} アルキニル基等）

(10) シクロアルキル-アルキル基（例えば、シクロプロピルメチル、シクロブチルメチル、シクロペンチルメチル、シクロヘキシルメチル、シクロヘプチルメチル、シクロプロピルエチル、シクロブチルエチル、シクロペンチルエチル、シクロヘキシルエチル、シクロヘプチルエチル、シクロプロピルプロピル、シクロブチルプロピル、シクロペンチルプロピル、シクロヘキシルプロピル、シクロヘプチルプロピル、シクロプロピルブチル、シクロブチルブチル、シクロペンチルブチル、シクロヘキシルブチル、シクロヘプチルブチル、シクロプロピルペンチル、シクロブチルペンチル、シクロペンチルペンチル、シクロヘキシルペンチル、シクロヘプチルペンチル、シクロプロピルヘキシル、シクロブチルヘキシル、シクロペンチルヘキシル、シクロヘキシルヘキシル等の C_{3-7} シクロアルキル- C_{1-6} アルキル基等）

(11) アリール-アリール- C_{1-10} アルキル基（例えばビフェニルメチル、ビフェニルエチル等）

R^1 で示される「置換基を有していてもよい炭化水素基」の「炭化水素基」の好ましいものとしては、例えば、 C_{1-6} アルキル基、 C_{3-6} シクロアルキル基、 C_{7-16} アラルキル基等である。更に好ましくは C_{7-10} アラルキル基（例えば、ベンジル、フェニルエチル、フェニルプロピル等のフェニル- C_{1-4} アルキル等）等である。

R^1 で示される「置換基を有していてもよい炭化水素基」の「置換基」としては、例えば、(i) ハロゲン原子（例えば、フルオロ、クロル、ブロム、ヨード等）、(ii) ニトロ基、(iii) シアノ基、(iv) オキソ基、(v) ヒドロキシ基、(vi) ハロゲン化されていてもよい低級アルキル基、(vii) ハロゲン化されていてもよい低級アルコキシ基、(viii) ハロゲン化されていてもよい低級アルキルチオ基、(ix) アミノ基、(x) モノ-低級アルキルアミノ基（例えば、メチルアミノ、エチルアミノ、プロピルアミノ等のモノ- C_{1-6} アルキルアミノ基等）、(xi) ジ-低級アルキルアミノ基（例えば、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ等のジ- C_{1-6} アルキルアミノ基等）、(xii) 例えば炭素原子

と1個の窒素原子以外に窒素原子、酸素原子及び硫黄原子等から選ばれるヘテロ原子を1ないし3個有していてもよい5ないし7員環状アミノ基（例えば、ピロリジノ、ピペリジノ、ピペラジノ、モルホリノ、チオモルホリノ等）、（xiii）低級アルキル-カルボニルアミノ基（例えば、アセチルアミノ、プロピオニルアミノ、ブチリルアミノ等のC₁₋₆アルキル-カルボニルアミノ基等）、（xiv）低級アルキルスルホニルアミノ基（例えば、メチルスルホニルアミノ、エチルスルホニルアミノ等のC₁₋₆アルキル-スルホニルアミノ基等）、（xv）低級アルコキシ-カルボニル基（例えば、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、プロポキシカルボニル等のC₁₋₆アルコキシ-カルボニル基等）、（xvi）カルボキシ基、（xvii）低級アルキル-カルボニル基（例えば、メチルカルボニル、エチルカルボニル、プロピルカルボニル等のC₁₋₆アルキル-カルボニル基等）、（xviii）カルバモイル基、チオカルバモイル基、（xix）モノ-低級アルキル-カルバモイル基（例えば、メチルカルバモイル、エチルカルバモイル等のモノ-C₁₋₆アルキル-カルバモイル基等）、（xx）ジ-低級アルキル-カルバモイル基（例えば、ジメチルカルバモイル、ジエチルカルバモイル等のジ-C₁₋₆アルキル-カルバモイル基等）、（xxi）低級アルキルスルホニル基（例えば、メチルスルホニル、エチルスルホニル、プロピルスルホニル等のC₁₋₆アルキルスルホニル基等）、（xxii）低級アルコキシ-カルボニル-低級アルキル基（例えば、メトキシカルボニルメチル、エトキシカルボニルメチル、tert-ブトキシカルボニルメチル、メトキシカルボニルエチル、メトキシカルボニルメチル、メトキシカルボニル（ジメチル）メチル、エトキシカルボニル（ジメチル）メチル、tert-ブトキシカルボニル（ジメチル）メチル等のC₁₋₆アルキル-カルボニル-C₁₋₆アルキル基等）、（xxiii）カルボキシ-低級アルキル基（例えば、カルボキシルメチル、カルボキシルエチル、カルボキシル（ジメチル）メチル等のカルボキシ-C₁₋₆アルキル基等）、（xxiv）置換基を有していてもよい複素環基、（xxv）C₆₋₁₄アリール基（例えば、フェニル、ナフチル等）、（xxvi）C₇₋₁₆アラルキル基（例えば、ベンジル等）、（xxvii）置換基を有していてもよいウレイド基（例えば、ウレイド、3-メチルウレイド、3-エチルウレイド、3-フェニルウレイド、3-（4-フルオロフェニル）ウレイド、3-（2-メチルフェニル）ウレイド、3-

(4-メトキシフェニル) ウレイド、3-(2, 4-ジフルオロフェニル) ウレイド、3-[3, 5-ビス(トリフルオロメチル)フェニル] ウレイド、3-ベンジルウレイド、3-(1-ナフチル) ウレイド、3-(2-ピフェニル) ウレイド等)、(xxviii) 置換基を有していてもよいチオウレイド基(例えば、チオウレイド、3-メチルチオウレイド、3-エチルチオウレイド、3-フェニルチオウレイド、3-(4-フルオロフェニル) チオウレイド、3-(4-メチルフェニル) チオウレイド、3-(4-メトキシフェニル) チオウレイド、3-(2, 4-ジクロロフェニル) チオウレイド、3-ベンジルチオウレイド、3-(1-ナフチル) チオウレイド等)、(xxix) 置換基を有していてもよいアミノ基(例えば、アミノ、 N^1 -メチルアミノ、 N^1 -エチルアミノ、 N^1 -フェニルアミノ、 N^1 , N^1 -ジメチルアミノ、 N^1 , N^2 -ジメチルアミノ、 N^1 -メチル- N^1 -エチルアミノ、 N^1 , N^1 -ジエチルアミノ、 N^1 -メチル- N^1 -フェニルアミノ、 N^1 , N^1 -ジ(4-ニトロフェニル)アミノ等)、(xxx) 置換基を有していてもよいグアニジノ基(例えば、グアニジノ、3-メチルグアニジノ、3, 3-ジメチルグアニジノ、3, 3-ジエチルグアニジノ等)、(xxxi) 置換基を有していてもよい環状アミノカルボニル基(例えば、ピロリジノカルボニル、ピペリジノカルボニル、(4-メチルピペリジノ)カルボニル、(4-フェニルピペリジノ)カルボニル、(4-ベンジルピペリジノ)カルボニル、(4-ベンゾイルピペリジノ)カルボニル、[4-(4-フルオロベンゾイル)ピペリジノ]カルボニル、(4-メチルピペラジノ)カルボニル、(4-フェニルピペラジノ)カルボニル、[4-(4-ニトロフェニル)ピペラジノ]カルボニル、(4-ベンジルピペラジノ)カルボニル、モルホリノカルボニル、チオモルホリノカルボニル等)、(xxxii) 置換基を有していてもよいアミノチオカルボニル基(例えば、アミノチオカルボニル、メチルアミノチオカルボニル、ジメチルアミノチオカルボニル等)、(xxxiii) 置換基を有していてもよいアミノスルホニル基(例えば、アミノスルホニル、メチルアミノスルホニル、ジメチルアミノスルホニル等)、(xxxiv) 置換基を有していてもよいフェニルスルホニルアミノ(例えば、フェニルスルホニルアミノ、(4-メチルフェニル)スルホニルアミノ、(4-クロロフェニル)スルホニルアミノ、(2, 5-ジクロロフェニル)スル

- ホニルアミノ、(4-メトキシフェニル)スルホニルアミノ、(4-アセチルアミノフェニル)スルホニルアミノ、(4-ニトロフェニル)フェニルスルホニルアミノ等)、(xxxv)スルホ基、(xxxvi)スルフィノ基、(xxxvii)スルフェノ基、(xxxviii) C_{1-6} アルキルスルホ基(例えば、メチルスルホ、エチルスルホ、プロピルスルホ等)、(xxxix) C_{1-6} アルキルスルフィノ基(例えば、メチルスルフィノ、エチルスルフィノ、プロピルスルフィノ等)、(xxxx) C_{1-6} アルキルスルフェノ基(例えば、メチルスルフェノ、エチルスルフェノ、プロピルスルフェノ等)、(xxxxi)ホスホノ基、(xxxxii)ジ- C_{1-6} アルコキシホスホリル基(例えば、ジメトキシホスホリル、ジエトキシホスホリル、ジプロポキシホスホリル等)等から選ばれた1ないし5個(好ましくは1ないし3個)が挙げられる。

- このうち好ましくは、ハロゲン原子、ハロゲン化されていてもよいアルキル基、ハロゲン化されていてもよいアルコキシ基、ヒドロキシ基、ニトロ基、シアノ基、カルボキシ基、 C_{1-6} アルコキシ-カルボニル基、カルバモイル基、アミノチオカルボニル基、モノ- C_{1-6} アルキル-カルバモイル基、ジ- C_{1-6} アルキル-カルバモイル基、アミノ基、モノ- C_{1-6} アルキルアミノ基、ジ- C_{1-6} アルキルアミノ基、5ないし7員環状アミノ基、 C_{1-6} アルキル-カルボニルアミノ基、フェニルスルホニルアミノ基、 C_{1-6} アルキルスルホニルアミノ基等が挙げられる。

- 上記「置換基を有していてもよい複素環基」の「複素環基」としては、例えば、窒素原子、酸素原子及び硫黄原子から選ばれるヘテロ原子1ないし6個(好ましくは1ないし4個)を含む5ないし14員(単環式又は2ないし4環式)複素環から水素原子を1個除去してできる基等が用いられる。

- 単環式複素環基としては、ピリジン、ピラジン、ピリミジン、イミダゾール、フラン、チオフェン、ジヒドロピリジン、ジアゼピン、オキサゼピン、ピロリジン、ピペリジン、ヘキサメチレンイミン、ヘプタメチレンイミン、テトラヒドロフラン、ピペラジン、ホモピペラジン、テトラヒドロオキサゼピン、モルホリン、チオモルホリン、ピロール、ピラゾール、1, 2, 3-トリアゾール、オキサゾール、オキサゾリジン、チアゾール、チアゾリジン、イソオキサゾール、イミダゾリン、トリアゾール、チアジアゾール、オキサジアゾール、

オキサチアジアゾール、トリアジン、テトラゾール等の単環式複素環から水素原子を1個除去してできる基等が挙げられる。

2環式複素環としては、例えば、インドール、ジヒドロインドール、イソインドール、ジヒドロイソインドール、ベンゾフラン、ジヒドロベンゾフラン、
5 ベンズイミダゾール、ベンズオキサゾール、ベンズイソオキサゾール、ベンゾチアゾール、インダゾール、キノリン、テトラヒドロキノリン、イソキノリン、テトラヒドロイソキノリン、テトラヒドロ-1H-1-ベンズアゼピン、テトラヒドロ-1H-2-ベンズアゼピン、テトラヒドロ-1H-3-ベンズアゼピン、テトラヒドロベンズオキサゼピン、キナゾリン、テトラヒドロキナゾリン、キノキサリン
10 、テトラヒドロキノキサリン、ベンゾジオキサン、ベンゾジオキソール、ベンゾチアジン、イミダゾピリジン等の2環式複素環から水素原子を1個除去してできる基等が用いられる。

3又は4環式複素環基としては、アクリジン、テトラヒドロアクリジン、ピロロキノリン、ピロロインドール、シクロペントインドール、イソインドロベンズアゼピン等の3又は4環式複素環から水素原子を1個除去してできる基等
15 が挙げられる。

該「複素環基」としては、単環又は2環式複素環から水素原子を1個除去してできる基等が好ましい。

該「置換基を有していてもよい複素環基」の「置換基」としては上記B環で
20 示される「置換基を有していてもよい複素環」の「置換基」が挙げられ、その置換基数は1ないし5個である。

R¹で示される「置換基を有していてもよい炭化水素基」として好ましくは、ハロゲン原子、C₁₋₆アルキル、C₁₋₆アルコキシ、ニトロ、シアノ及びヒドロキシから選ばれる置換基を1ないし5個有していてもよいC₇₋₁₆アラルキ
25 ル基（好ましくはベンジル等）等が挙げられる。

上記R¹で示される「アシル基」としては、例えば、式：

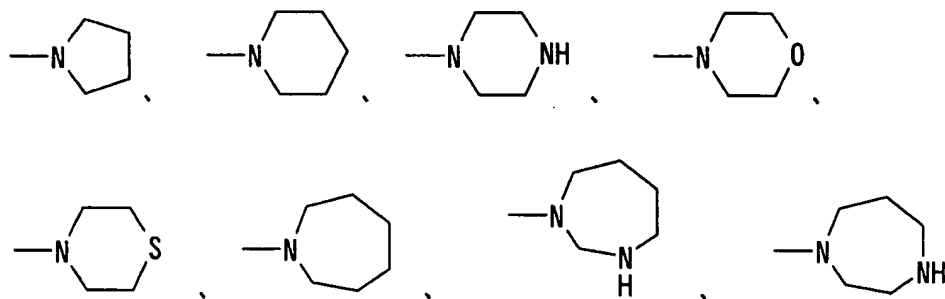
-(C=O)-R²、-(C=O)-OR²、-(C=O)-NR²R³、-SO₂-R²、-SO-R²、-(C=S)-OR² 又は -(C=S)NR²R³〔式中、R²及びR³はそれぞれ (i) 水素原子、(ii) 置換基を有していてもよい炭化水素基又は (iii) 置換基を有していてもよい複素環基を示すか、R²とR³とは互
30

いに結合して隣接する窒素原子と共に置換基を有していてもよい含窒素環基を形成してもよい。) で表されるアシル基等が挙げられる。

このうち好ましくは、式： $-(C=O)-R^2$ 又は $-(C=O)-NR^2R^3$ 〔式中、各記号は前記と同意義を示す。〕で表されるアシル基である。

- 5 R^2 又は R^3 で示される「置換基を有していてもよい炭化水素基」及び「置換基を有していてもよい複素環基」は、上記 R^1 で示される「置換基を有していてもよい炭化水素基」及び「置換基を有していてもよい複素環基」と同様のものがそれぞれ挙げられる。

- 10 R^2 と R^3 とで形成される「置換基を有していてもよい含窒素環基」としては、炭素原子及び1個の窒素原子以外に、例えば窒素原子、酸素原子及び硫黄原子から選ばれるヘテロ原子を1ないし3個含有していてもよい5ないし9員（好ましくは5ないし7員）の含窒素飽和複素環基等が挙げられる。より具体的には、例えば、式



- 15 で表される基等が挙げられる。

該「置換基を有していてもよい含窒素環基」の「置換基」としては、上記B環で示される「置換基を有していてもよい複素環」の「置換基」と同様のものが挙げられ、その置換基数は1ないし5個である。

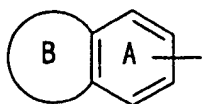
- 20 R^2 及び R^3 として、好ましくは、(i) 水素原子、(ii) ハロゲン化されていてもよい C_{1-6} アルキル、(iii) C_{1-6} アルキル及び C_{1-6} アルコキシから選ばれる置換基を1ないし3個有していてもよい C_{6-10} アリール、(iii) C_{7-16} アラルキル（例、ベンジル等）、(iv) 5又は6員複素環基（例、ピリジル、チエニル、フリル等）等が挙げられる。

- 25 上記 R^1 で示される「アシル基」として、好ましくは、ホルミル、ハロゲン化されていてもよい C_{1-6} アルキル-カルボニル（例、アセチル、トリフルオ

ロアセチル、プロピオニル等)、5又は6員複素環カルボニル(例、ピリジルカルボニル、チエニルカルボニル、フリルカルボニル等)、 C_{6-14} アリール-カルボニル(例、ベンゾイル、1-ナフトイル、2-ナフトイル等)、 C_{7-16} アラルキル-カルボニル(例、フェニルアセチル、3-フェニルプロピオニル等)、 C_{6-10} アリールスルホニル(例、ベンゼンスルホニル、ナフチルスルホニル等)等が挙げられる。

R^1 は、好ましくは、水素原子、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アルキル-カルボニル、 C_{6-14} アリール-カルボニル等である。

上記式



10

15

20

25

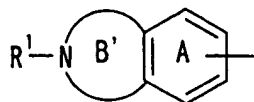
で表される基の具体例としては、2, 3-ジヒドロベンゾフラン; 3, 4-ジヒドロ-2H-1-ベンゾチオピラン; 2, 3-ジヒドロ-1H-インドール; 1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン; 2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール; 1, 2, 3, 4-テトラヒドロイソキノリン; 2, 3, 4, 5-テトラヒドロ-1H-1-ベンズアゼピン、2, 3, 4, 5-テトラヒドロ-1H-2-ベンズアゼピン、2, 3, 4, 5-テトラヒドロ-1H-3-ベンズアゼピン等のベンズアゼピン; 1, 2, 3, 4, 5, 6-ヘキサヒドロ-1-ベンズアゾシン、1, 2, 3, 4, 5, 6-ヘキサヒドロ-2-ベンズアゾシン、1, 2, 3, 4, 5, 6-ヘキサヒドロ-3-ベンズアゾシン等のベンズアゾシン; 2, 3, 4, 5, 6, 7-ヘキサヒドロ-1H-1-ベンズアゾニン、2, 3, 4, 5, 6, 7-ヘキサヒドロ-1H-2-ベンズアゾニン、2, 3, 4, 5, 6, 7-ヘキサヒドロ-1H-3-ベンズアゾニン、2, 3, 4, 5, 6, 7-ヘキサヒドロ-1H-4-ベンズアゾニン等のベンズアゾニン; 2, 3-ジヒドロベンズオキサゾール等のベンズオキサゾール; 2, 3-ジヒドロ-1H-ベンズイミダゾール等のベンズイミダゾール; 3, 4-ジヒドロ-1H-2, 1-ベンズオキサジン、3, 4-ジヒドロ-1H-2, 3-ベンズオキサジン、3, 4-ジヒドロ-2H-1, 2-ベンズオキサジン、3, 4-ジヒドロ-2H-1, 4-ベンズオキサジン、3, 4-ジヒドロ-2H-1, 3-ベンズオキサジン、3, 4-ジヒドロ-2H-3, 1-ベンズオキサジ

ン等のベンズオキサジン；3，4-ジヒドロ-1H-2，1-ベンゾチアジン、3，4-ジヒドロ-1H-2，3-ベンゾチアジン、3，4-ジヒドロ-2H-1，2-ベンゾチアジン、3，4-ジヒドロ-2H-1，4-ベンゾチアジン、3，4-ジヒドロ-2H-1，3-ベンゾチアジン、3，4-ジヒドロ-2H-3，1-ベンゾチアジン等のベンゾチアジン；1，2，3，4-テトラヒドロシンノリン、1，2，3，4-テトラヒドロフタラジン、1，2，3，4-テトラヒドロキナゾリン、1，2，3，4-テトラヒドロキノキサリン等のベンゾジアジン；3，4-ジヒドロ-1，2-ベンズオキサチン、3，4-ジヒドロ-2，1-ベンズオキサチン、2，3-ジヒドロ-1，4-ベンズオキサチン、1，4-ジヒドロ-2，3-ベンズオキサチン、4H-1，3-ベンズオキサチン、4H-3，1-ベンズオキサチン等のベンズオキサチン；3，4-ジヒドロ-1，2-ベンゾジオキシン、2，3-ジヒドロ-1，4-ベンゾジオキシン、1，4-ジヒドロ-2，3-ベンゾジオキシン、4H-1，3-ベンゾジオキシン等のベンゾジオキシン；3，4-ジヒドロ-1，2-ベンズジチン、2，3-ジヒドロ-1，4-ベンズジチン、1，4-ジヒドロ-2，3-ベンズジチン、4H-1，3-ベンズジチン等のベンズジチン；2，3，4，5-テトラヒドロ-1，2-ベンズオキサゼピン、2，3，4，5-テトラヒドロ-1，3-ベンズオキサゼピン、2，3，4，5-テトラヒドロ-1，4-ベンズオキサゼピン、2，3，4，5-テトラヒドロ-1，5-ベンズオキサゼピン、1，3，4，5-テトラヒドロ-2，1-ベンズオキサゼピン、1，3，4，5-テトラヒドロ-2，3-ベンズオキサゼピン、1，3，4，5-テトラヒドロ-2，4-ベンズオキサゼピン、1，2，4，5-テトラヒドロ-3，1-ベンズオキサゼピン、1，2，4，5-テトラヒドロ-3，2-ベンズオキサゼピン、1，2，3，5-テトラヒドロ-4，1-ベンズオキサゼピン等のベンズオキサゼピン；2，3，4，5-テトラヒドロ-1，2-ベンゾチアゼピン、2，3，4，5-テトラヒドロ-1，4-ベンゾチアゼピン、2，3，4，5-テトラヒドロ-1，5-ベンゾチアゼピン、1，3，4，5-テトラヒドロ-2，1-ベンゾチアゼピン、1，3，4，5-テトラヒドロ-2，4-ベンゾチアゼピン、1，2，4，5-テトラヒドロ-3，1-ベンゾチアゼピン、1，2，4，5-テト

- ラヒドロ-3, 2-ベンゾチアゼピン、1, 2, 3, 5-テトラヒドロ-4, 1-ベンゾチアゼピン等のベンゾチアゼピン; 2, 3, 4, 5-テトラヒドロ-1H-1, 2-ベンゾチアゼピン、2, 3, 4, 5-テトラヒドロ-1H-1, 3-ベンゾジアゼピン、2, 3, 4, 5-テトラヒドロ-1H-1, 4-
 5 ベンゾジアゼピン、2, 3, 4, 5-テトラヒドロ-1H-1, 5-ベンゾジアゼピン、2, 3, 4, 5-テトラヒドロ-1H-2, 3-ベンゾジアゼピン、2, 3, 4, 5-テトラヒドロ-1H-2, 4-ベンゾジアゼピン等のベンゾジアゼピン; 4, 5-ジヒドロ-1, 3-ベンゾジオキセピン、4, 5-ジヒドロ-3H-1, 2-ベンゾジオキセピン、2, 3-ジヒドロ-5H-1,
 10 4-ベンゾジオキセピン、3, 4-ジヒドロ-2H-1, 5-ベンゾジオキセピン、4, 5-ジヒドロ-1H-2, 3-ベンゾジオキセピン、1, 5-ジヒドロ-2, 4-ベンゾジオキセピン等のベンゾジオキセピン; 4, 5-ジヒドロ-1H-2, 3-ベンゾチエピン、1, 5-ジヒドロ-2, 4-ベンゾジチエピン、3, 4-ジヒドロ-2H-1, 5-ベンゾジチエピン、2, 3-ジヒ
 15 ドロ-5H-1, 4-ベンゾジチエピン等のベンゾジチエピン、3, 4, 5, 6-テトラヒドロ-2H-1, 5-ベンズオキサゾシン、3, 4, 5, 6-テトラヒドロ-2H-1, 6-ベンズオキサゾシン等のベンズオキサゾシン; 3, 4, 5, 6-テトラヒドロ-2H-1, 5-ベンゾチアゾシン、3, 4, 5, 6-テトラヒドロ-2H-1, 6-ベンゾチアゾシン等のベンゾチアゾシン
 20 ; 1, 2, 3, 4, 5, 6-ヘキサヒドロ-1, 6-ベンゾジアゾシン等のベンゾジアゾシン; 2, 3, 4, 5-テトラヒドロ-1, 6-ベンズオキサチオシン等のベンズオキサチオシン; 2, 3, 4, 5-テトラヒドロ-1, 6-ベンゾジオキソシン等のベンゾジオキソシン; 1, 3, 5-ベンゾトリオキセピン、5H-1, 3, 4-ベンゾトリオキセピン等のベンゾトリオキセピン; 3
 25 , 4-ジヒドロ-1H-5, 2, 1-ベンズオキサチアゼピン、3, 4-ジヒドロ-2H-5, 1, 2-ベンズオキサチアゼピン、4, 5-ジヒドロ-3, 1, 4-ベンズオキサチアゼピン、4, 5-ジヒドロ-3H-1, 2, 5-ベンズオキサチアゼピン等のベンズオキサチアゼピン; 2, 3, 4, 5-テトラヒドロ-1, 3, 4-ベンズオキサジアゼピン等のベンズオキサジアゼピン;
 30 2, 3, 4, 5-テトラヒドロ-1, 3, 5-ベンズチアジアゼピン等のベン

ズチアジアゼピン；2, 3, 4, 5-テトラヒドロ-1H-1, 2, 5-ベン
 ソトリアゼピン等のベンゾトリアゼピン；4, 5-ジヒドロ-1, 3, 2-ベ
 ンゾオキサチエピン、4, 5-ジヒドロ-1H-2, 3-ベンズオキサチエピ
 ン、3, 4-ジヒドロ-2H-1, 5-ベンズオキサチエピン、4, 5-ジヒ
 5 ドロ-3H-1, 2-ベンズオキサチエピン、4, 5-ジヒドロ-3H-2,
 1-ベンズオキサチエピン、2, 3-ジヒドロ-5H-1, 4-ベンズオキサ
 チエピン、2, 3-ジヒドロ-5H-4, 1-ベンズオキサチエピン等、とり
 わけ2, 3, 4, 5-テトラヒドロ-1H-3-ベンズアゼピン、2, 3, 4, 5-
 テトラヒドロ-1H-2-ベンズアゼピン、2, 3-ジヒドロ-1H-インドー
 10 ル、2, 3, 4, 5-テトラヒドロ-1, 4-ベンズオキサゼピン等の2環式縮合
 ベンゼン環から水素原子を1個除去してできる基等が挙げられる。

このうち、好ましい例としては式

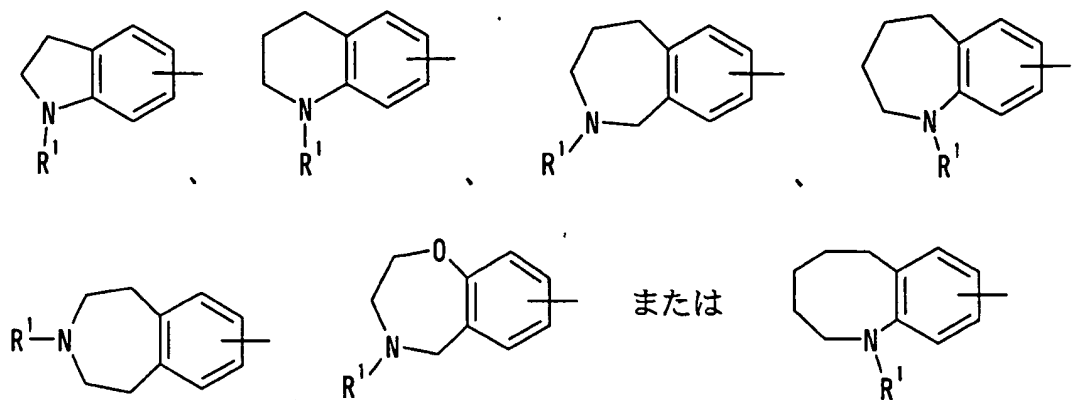


〔式中、B'環はオキソ基で更に置換されていてもよい5ないし9員の含窒素複
 15 素環、その他の各記号は前記と同意義を示す。〕で表される基等が挙げられる

。該「オキソ基で更に置換されていてもよい5ないし9員の含窒素複素環」の
 「5ないし9員の含窒素複素環」としては、炭素原子及び1個の窒素原子以外
 に、例えば窒素原子、酸素原子及び硫黄原子から選ばれるヘテロ原子を1ない
 20 し3個含有していてもよい5ないし9員の含窒素複素環等が挙げられ、5ない
 し9員の非芳香族含窒素複素環（例えば、ピロリジン、ピペリジン、ヘキサメ
 チレンイミン、ヘプタメチレンイミン、ピペラジン、ホモピペラジン、テトラ
 ヒドロオキサゼピン、モルホリン、チオモルホリン等）等が好ましく用いられ
 る。

25 このうち、より好ましい例としては、式

29

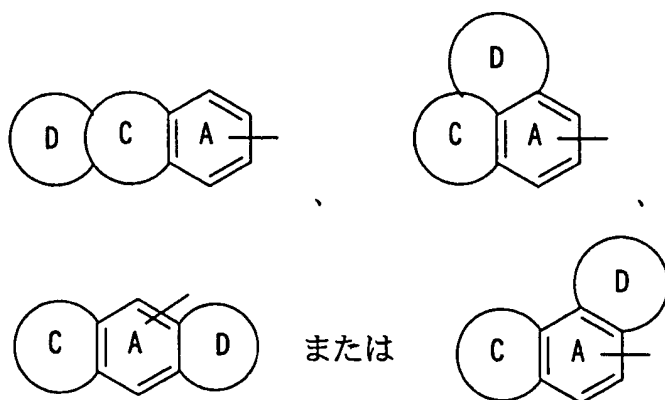


〔式中、 R^1 は前記と同意義を示す。〕で表される基等が挙げられる。特に好ましくは、式



5 〔式中、 R^1 は前記と同意義を示す。〕で表される基等が挙げられる。

上記(2)の「縮合していてもよいフェニル基で、該フェニル基は置換基を有していてもよい」のフェニル基が置換基を有していてもよい2環式複素環と縮合する、あるいは2つの同一又は異なった単環（但し、少なくとも一方の環が単環式複素環である）と縮合する場合の具体例としては、例えば、式



10

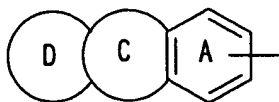
〔式中、A環は上記と同意義、C環及びD環の一方は置換基を有していてもよい複素環、他方は置換基を有していてもよい5ないし9員環を示す。〕で表される基等が挙げられる。

C環又はD環で示される「置換基を有していてもよい複素環」の「複素環」としては、B環で示される「置換基を有していてもよい複素環」が挙げられる。

C環又はD環で示される「置換基を有していてもよい5ないし9員環」の「5ないし9員環」は、窒素原子、酸素原子及び硫黄原子から選ばれるヘテロ原子を1ないし3個含有していてもよく、例えば、5ないし9員複素環（例えば、ピリジン、ピラジン、ピリミジン、イミダゾール、フラン、チオフェン、ジヒドロピリジン、ジアゼピン、オキサゼピン、ピロリジン、ピペリジン、ヘキサメチレンイミン、ヘプタメチレンイミン、テトラヒドロフラン、ピペラジン、ホモピペラジン、テトラヒドロオキサゼピン、モルホリン、チオモルホリン等）、5ないし9員炭素環（例えば、ベンゼン、シクロペンタン、シクロペンテン、シクロヘキサン、シクロヘキセン、シクロヘキサジエン、シクロヘプタン、シクロヘプテン、シクロヘプタジエン等）等が挙げられる。このうち、5ないし7員環が好ましい。中でも、ベンゼン、シクロヘキサン等が好ましい。

「置換基を有していてもよい5ないし9員環」の「置換基」としては、上記B環で示される「置換基を有していてもよい複素環」の「置換基」と同様のものが挙げられる。

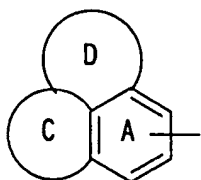
上記式



〔式中、各記号は上記と同意義を示す。〕で表される基の具体例としては、カルバゾール、1, 2, 3, 4, 4a, 9a-ヘキサヒドロカルバゾール、9, 10-ジヒドロアクリジン、1, 2, 3, 4-テトラヒドロアクリジン、10, 11-ジヒドロ-5H-ジベンズ〔b, f〕アゼピン、5, 6, 7, 12-テトラヒドロジベンズ〔b, g〕アゾシン、6, 11-ジヒドロ-5H-ジベンズ〔b, e〕アゼピン、6, 7-ジヒドロ-5H-ジベンズ〔c, e〕アゼピン、5, 6, 11, 12-テトラヒドロジベンズ〔b, f〕アゾシン、ジベンゾフラン、9H-キサンテン、10, 11-ジヒドロジベンズ〔b, f〕オキセピン、6, 11-ジヒドロジベンズ〔b, e〕オキセピン、6, 7-ジヒ

ドロー5H-ジベンズ〔b, g〕オキソシン、ジベンゾチオフェン、9H-チ
 オキサンテン、10, 11-ジヒドロジベンゾ〔b, f〕チエピン、6, 11-
 ジヒドロジベンゾ〔b, e〕チエピン、6, 7-ジヒドロ-5H-ジベンゾ
 〔b, g〕チオシン、10H-フェノチアジン、10H-フェノキサジン、5
 5, 10-ジヒドロフェナジン、10, 11-ジベンゾ〔b, f〕〔1, 4〕チ
 アゼピン、10, 11-ジヒドロジベンズ〔b, f〕〔1, 4〕オキサゼピン
 、2, 3, 5, 6, 11, 11a-ヘキサヒドロ-1H-ピロロ〔2, 1-b
 〕〔3〕ベンズアゼピン、10, 11-ジヒドロ-5H-ジベンゾ〔b, e〕
 〔1, 4〕ジアゼピン、5, 11-ジヒドロジベンズ〔b, e〕〔1, 4〕オ
 10キサゼピン、5, 11-ジヒドロジベンゾ〔b, f〕〔1, 4〕チアゼピン、
 10, 11-ジヒドロ-5H-ジベンゾ〔b, e〕〔1, 4〕ジアゼピン、1
 , 2, 3, 3a, 8, 8a-ヘキサヒドロピロロ〔2, 3-b〕インドール等
 の3環式縮合ベンゼン環から水素原子を1個除去してできる基が挙げられる。

上記式

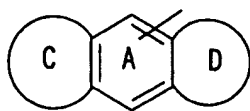


15

〔式中、各記号は上記と同意義を示す。〕で表される基の具体例としては、1
 H, 3H-ナフト〔1, 8-cd〕〔1, 2〕オキサジン、ナフト〔1, 8-
 de〕-1, 3-オキサジン、ナフト〔1, 8-de〕-1, 2-オキサジン
 、1, 2, 2a, 3, 4, 5-ヘキサヒドロベンズ〔cd〕インドール、2,
 20 3, 3a, 4, 5, 6-ヘキサヒドロ-1H-ベンゾ〔de〕キノリン、4H-
 ピロロ〔3, 2, 1-ij〕キノリン、1, 2, 5, 6-テトラヒドロ-4
 H-ピロロ〔3, 2, 1-ij〕キノリン、5, 6-ジヒドロ-4H-ピロロ
 〔3, 2, 1-ij〕キノリン、1H, 5H-ベンゾ〔ij〕キノリジン、ア
 ゼピノ〔3, 2, 1-hi〕インドール、1, 2, 4, 5, 6, 7-ヘキサヒ
 25 ドロアゼピノ〔3, 2, 1-hi〕インドール、1H-ピリド〔3, 2, 1-
 jk〕〔1〕ベンズアゼピン、5, 6, 7, 8-テトラヒドロ-1H-ピリド
 〔3, 2, 1-jk〕〔1〕ベンズアゼピン、1, 2, 5, 6, 7, 8-ヘキ

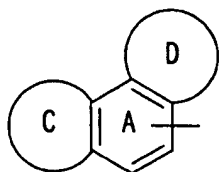
- 5 サヒドロ-1H-ピリド〔3, 2, 1-j k〕〔1〕ベンズアゼピン、2, 3-ジヒドロ-1H-ベンズ〔d e〕イソキノリン、1, 2, 3, 4, 4a, 5, 6, 7-オクタヒドロナフト〔1, 8-b c〕アゼピン、2, 3, 5, 6, 7, 8-ヘキサヒドロ-1H-ピリド〔3, 2, 1-j k〕〔1〕ベンズアゼピン等の3環式縮合ベンゼン環から水素原子を1個除去してできる基が挙げられる。

上記式



- 10 〔式中、各記号は上記と同意義を示す。〕で表される基の具体例としては、1, 2, 3, 5, 6, 7-ヘキサヒドロベンゾ〔1, 2-b: 4, 5-b'〕ジピロール、1, 2, 3, 5, 6, 7-ヘキサヒドロシクロペント〔f〕インドール等の3環式縮合ベンゼン環から水素原子を1個除去してできる基が挙げられる。

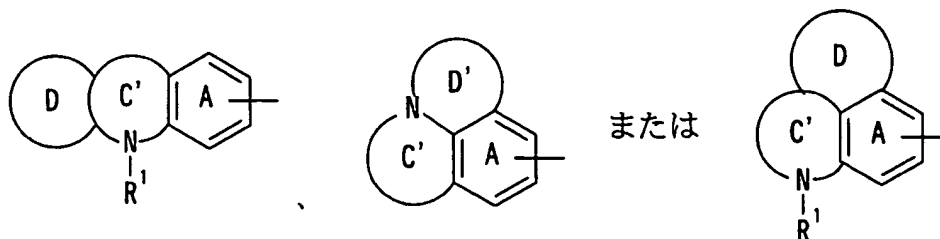
上記式



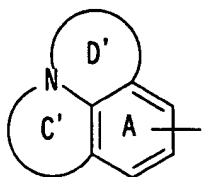
15

- 〔式中、各記号は上記と同意義を示す。〕で表される基の具体例としては、1, 2, 3, 6, 7, 8-ヘキサヒドロシクロペント〔e〕インドール、2, 3, 4, 7, 8, 9-ヘキサヒドロ-1H-シクロペンタ〔f〕キノリン等の3環式縮合ベンゼン環から水素原子を1個除去してできる基が挙げられる。

- 20 このうち、式



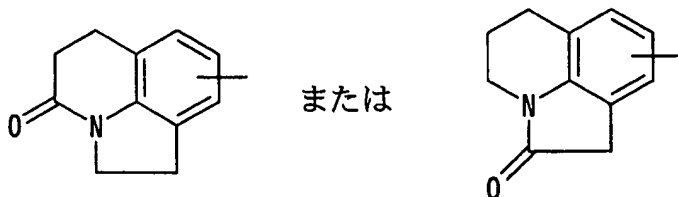
〔式中、C'環及びD'環は、それぞれオキソ基で更に置換されていてもよい5ないし9員の含窒素複素環、その他の各記号は前記と同意義を示す。〕で表される基等が好ましい。このうち式



5 〔式中、各記号は前記と同意義を示す。〕で表される基等が更に好ましい。

C'環又はD'環で示される「オキソ基で更に置換されていてもよい5ないし9員の含窒素複素環」は、B'環で示される「オキソ基で更に置換されていてもよい5ないし9員の含窒素複素環」と同様のものが挙げられる。

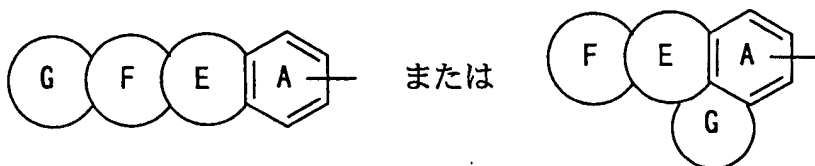
中でもより好ましくは、式



10

で表される基等が挙げられる。

上記(3)の「縮合していてもよいフェニル基で、該フェニル基は置換基を有していてもよい」のフェニル基が置換基を有していてもよい3環式複素環と縮合する場合の具体例としては、例えば、式



15

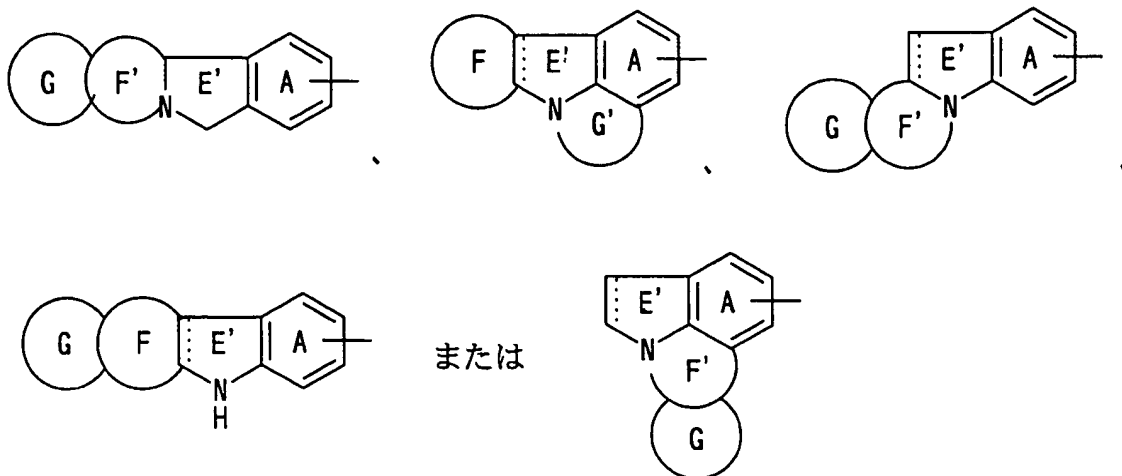
〔式中、A環は上記と同意義、E環、F環及びG環の少なくとも一つの環は置換基を有していてもよい複素環、その他の環は置換基を有していてもよい5ないし9員環を示す。〕で表される基等が挙げられる。

20 E環、F環又はG環で示される「置換基を有していてもよい複素環」及び「置換基を有していてもよい5ないし9員環」は、B環又はC環で示される「置換基を有していてもよい複素環」及び「置換基を有していてもよい5ないし9

員環」がそれぞれ挙げられる。

このうち、好ましくは

(i) 式

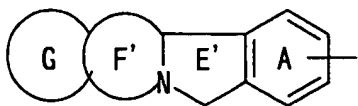


- 5 〔式中、A環は前記と同意義、E'環、F'環及びG'環は、それぞれオキソ基で更に置換されていてもよい5ないし9員の含窒素複素環、及び ---は単結合又は二重結合を示す。〕で表される基、

- (ii) 例えば、フルオランテン、アセフェナントリレン、アセアントリレン、トリフェニレン、ピレン、クリセン、ナфтаセン、プレイアデン、ベンゾ [a] アントラセン、インデノ [1, 2-a] インデン、シクロペンタ [a] フェナントレン、ピリド [1', 2' : 1, 2] イミダゾ [4, 5-b] キノキサリン、1H-2-オキサピレン、スピロ [ピペリジン-4, 9'-キサンテン] 等の環から水素原子を1個除去してできる基、及びこれらのジヒドロ体、テトラヒドロ体、ヘキサヒドロ体、オクタヒドロ体、デカヒドロ体等が挙げられる。
- 10
- 15

E'環、F'環及びG'環で示される「オキソ基で更に置換されていてもよい5ないし9員の含窒素複素環」は、B'環で示される「オキソ基で更に置換されていてもよい5ないし9員の含窒素複素環」と同様のものが挙げられる。

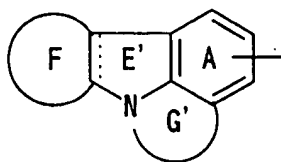
上記式



〔式中、各記号は前記と同意義を示す。〕で表される基の具体例としては、2
 H-イソインドロ〔2, 1-e〕プリン, 1H-ピラゾロ〔4', 3': 3, 4〕
 ピリド〔2, 1-a〕イソインドール, 1H-ピリド〔2', 3': 4, 5〕イミ
 ダゾ〔2, 1-a〕イソインドール, 2H, 6H-ピリド〔1', 2': 3, 4〕
 5 イミダゾ〔5, 1-a〕イソインドール, 1H-イソインドロ〔2, 1-a〕ベン
 ズイミダゾール, 1H-ピリド〔3', 4': 4, 5〕ピロロ〔2, 1-a〕イソ
 インドール, 2H-ピリド〔4', 3': 4, 5〕ピロロ〔2, 1-a〕イソイン
 ドール, 1H-イソインドロ〔2, 1-a〕インドール, 2H-イソインドロ〔
 1, 2-a〕イソインドール, 1H-シクロペンタ〔4, 5〕ピリミド〔2, 1-
 10 a〕イソインドール, 2H, 4H-ピラノ〔4', 3': 4, 5〕〔1, 3〕オキ
 サジノ〔2, 3-a〕イソインドール, 2H-イソインドロ〔2, 1-a〕〔3,
 1〕ベンズオキサジン, 7H-イソインドロ〔1, 2-b〕〔1, 3〕ベンズオキ
 サジン, 2H-ピリド〔2', 1': 3, 4〕ピラジノ〔2, 1-a〕イソイン
 ドール, ピリド〔2', 3': 4, 5〕ピリミド〔2, 1-a〕イソインドール, ピ
 15 リド〔3', 2': 5, 6〕ピリミド〔2, 1-a〕イソインドール, 1H-ピリ
 ド〔1', 2': 3, 4〕ピリミド〔2, 1-a〕イソインドール, イソインドロ
 〔2, 1-a〕キナゾリン, イソインドロ〔2, 1-a〕キノキサリン, イソイン
 ドロ〔1, 2-a〕イソキノリン, イソインドロ〔2, 1-b〕イソキノリン, イ
 ソインドロ〔2, 1-a〕キノリン, 6H-オキサジノ〔3', 4': 3, 4〕〔
 20 1, 4〕ジアゼピノ〔2, 1-a〕イソインドール, アゼピノ〔2', 1': 3, 4
 〕ピラジノ〔2, 1-a〕イソインドール, 2H, 6H-ピリド〔2', 1': 3
 , 4〕〔1, 4〕ジアゼピノ〔2, 1-a〕イソインドール, 1H-イソインドロ
 〔1, 2-b〕〔1, 3, 4〕ベンゾトリアゼピン, 2H-イソインドロ〔2, 1-
 a〕〔1, 3, 4〕ベンゾトリアゼピン, イソインドロ〔2, 1-d〕〔1, 4〕ベ
 25 ンズオキサゼピン, 1H-イソインドロ〔2, 1-b〕〔2, 4〕ベンゾジアゼピ
 ン, 1H-イソインドロ〔2, 1-c〕〔2, 3〕ベンゾジアゼピン, 2H-イソ
 インドロ〔1, 2-a〕〔2, 4〕ベンゾジアゼピン, 2H-イソインドロ〔2,
 1-d〕〔1, 4〕ベンゾジアゼピン, 5H-インドロ〔2, 1-b〕〔3〕ベン
 ズアゼピン, 2H-イソインドロ〔1, 2-a〕〔2〕ベンズアゼピン, 2H-
 30 イソインドロ〔1, 2-b〕〔3〕ベンズアゼピン, 2H-イソインドロ〔2,

- 1-b) [2] ベンズアゼピン, 2H-イソインドロ [1, 2-b] [1, 3, 4]
 ベンゾオキサジアゾシン, イソインドロ [2, 1-b] [1, 2, 6] ベンゾトリ
 アゾシン, 5H-4, 8-メタノ-1H- [1, 5] ジアザシクロウンデシノ [1, 11-a]
 インドール等の4環式縮合ベンゼン環から水素原子を1個除去して
 5 できる基が挙げられる。

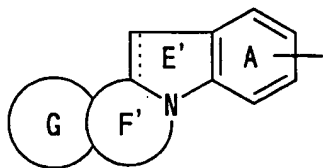
上記式



- [式中、各記号は前記と同意義を示す。] で表される基の具体例としては、1
 H, 4H-ピロロ [3', 2' : 4, 5] ピロロ [3, 2, 1-ij] キノリン, ピロ
 10 ロ [3, 2, 1-jk] カルバゾール, 1H-フロ [2', 3' : 4, 5] ピロロ [3
 , 2, 1-ij] キノリン, 1H, 4H-シクロペンタ [4, 5] ピロロ [1, 2,
 3-de] キノキサリン, 1H, 4H-シクロペンタ [4, 5] ピロロ [3, 2,
 1-ij] キノリン, ピリド [3', 4' : 4, 5] ピロロ [1, 2, 3-de] ベンズ
 オキサジン, [1, 4] オキサジノ [2, 3, 4-jk] カルバゾール, 1H, 3H
 15 - [1, 3] オキサジノ [5, 4, 3-jk] カルバゾール, ピリド [3', 4' : 4
 , 5] ピロロ [1, 2, 3-de] [1, 4] ベンゾチアジン, 4H-ピロロ [3,
 2, 1-de] フェナンスリジン, 4H, 5H-ピリド [3, 2, 1-de] フェナン
 スリジン, 1H, 4H-3a, 6a-ジアザフルオロアンテン, 1-オキサ-4,
 6a-ジアザフルオロアンテン, 4-オキサ-2, 10b-ジアザフルオロアン
 20 テン, 1-チア-4, 6a-ジアザフルオロアンテン, 1H-ピラジノ [3, 2,
 1-jk] カルバゾール, 1H-インドロ [3, 2, 1-de] [1, 5] ナフチリジ
 ン, ベンゾ [b] ピラノ [2, 3, 4-hi] インドリジン, 1H, 3H-ベンゾ [b]
 [b] ピラノ [3, 4, 5-hi] インドリジン, 1H, 4H-ピラノ [2', 3' : 4
 , 5] ピロロ [3, 2, 1-ij] キノリン, 1H, 3H-ベンゾ [b] チオピラノ
 25 [3, 4, 5-hi] インドリジン, 1H-ピリド [3, 2, 1-jk] カルバゾール
 , 4H-3-オキサ-11b-アザシクロヘプタ [jk] フルオレン, 2H-アゼ
 ピノ [1', 2' : 1, 2] ピリミジノ [4, 5-b] インドール, 1H, 4H-シ

クロヘプタ〔4, 5〕ピロロ〔1, 2, 3-de〕キノキサリン, 5H-ピリド〔3', 4' : 4, 5〕ピロロ〔1, 2, 3-ef〕〔1, 5〕ベンズオキサゼピン, 4H-ピリド〔3', 4' : 4, 5〕ピロロ〔3, 2, 1-jk〕〔4, 1〕ベンゾチアゼピン, 5H-ピリド〔3', 4' : 4, 5〕ピロロ〔1, 2, 3-ef〕〔1, 5〕ベンゾチアゼピン, 5H-ピリド〔4', 3' : 4, 5〕ピロロ〔1, 2, 3-ef〕〔1, 5〕ベンゾチアゼピン, 〔1, 2, 4〕トリアゼピノ〔6, 5, 4-jk〕カルバゾール, 〔1, 2, 4〕トリアゼピノ〔6, 7, 1-jk〕カルバゾール, 〔1, 2, 5〕トリアゼピノ〔3, 4, 5-jk〕カルバゾール, 5H-〔1, 4〕オキサゼピノ〔2, 3, 4-jk〕カルバゾール, 5H-〔1, 4〕チアゼピノ〔2, 3, 4-jk〕カルバゾール, 〔1, 4〕ジアゼピノ〔3, 2, 1-jk〕カルバゾール, 〔1, 4〕ジアゼピノ〔6, 7, 1-jk〕カルバゾール, アゼピノ〔3, 2, 1-jk〕カルバゾール, 1H-シクロオクタ〔4, 5〕ピロロ〔1, 2, 3-de〕キノキサリン, 1H-シクロオクタ〔4, 5〕ピロロ〔3, 2, 1-ij〕キノリン等の4環式縮合ベンゼン環から水素原子を1個除去してできる基が挙げられる。

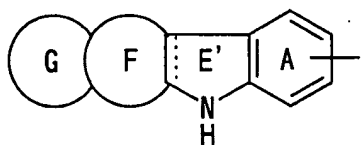
15 上記式



〔式中、各記号は前記と同意義を示す。〕で表される基の具体例としては、1H-インドロ〔1, 2-a〕ベンズイミダゾール, 1H-インドロ〔1, 2-b〕インダゾール, ピロロ〔2', 1' : 3, 4〕ピラジノ〔1, 2-a〕インドール, 20 1H, 5H-ピロロ〔1', 2' : 4, 5〕ピラジノ〔1, 2-a〕インドール, 2H-ピリド〔2', 3' : 3, 4〕ピロロ〔1, 2-a〕インドール, 1H-ピロロ〔2', 3' : 3, 4〕ピリド〔1, 2-a〕インドール, 1H-インドロ〔1, 2-a〕インドール, 6H-イソインドロ〔2, 1-a〕インドール, 6H-インドロ〔1, 2-c〕〔1, 3〕ベンズオキサジン, 1H-インドロ〔1, 2-b〕〔1, 2〕ベンゾチアジン, 25 ピリミド〔4', 5' : 4, 5〕ピリミド〔1, 6-a〕インドール, ピラジノ〔2', 3' : 3, 4〕ピリド〔1, 2-a〕インドール, 6H-ピリド〔1', 2' : 3, 4〕ピリミド〔1, 6-a〕インドール, インドロ〔1

- , 2-b) シンノリン, インドロ [1, 2-a] キナゾリン, インドロ [1, 2-c]
) キナゾリン, インドロ [2, 1-b] キナゾリン, インドロ [1, 2-a] キノ
 キサリン, インドロ [1, 2-a] [1, 8] ナフチリジン, インドロ [1, 2-b]
) - 2, 6-ナフチリジン, インドロ [1, 2-b] [2, 7] ナフチリジン, イ
 5 インドロ [1, 2-b] - 1, 7-ナフチリジン, インドロ [1, 2-b] イソキノリ
 ン, インドロ [2, 1-a] イソキノリン, インドロ [1, 2-a] キノリン, 2
 H, 6H-ピリド [2', 1' : 3, 4] [1, 4] ジアゼピノ [1, 2-a] イン
 ドール, 1H-インドロ [2, 1-c] [1, 4] ベンゾジアゼピン, 2H-イン
 ドロ [1, 2-d] [1, 4] ベンゾジアゼピン, 2H-インドロ [2, 1-a] [
 10 2, 3] ベンゾジアゼピン, 2H-インドロ [2, 1-b] [1, 3] ベンゾジア
 ゼピン, 1H-インドロ [1, 2-b] [2] ベンズアゼピン, 2H-インドロ
 [1, 2-a] [1] ベンズアゼピン, 2H-インドロ [2, 1-a] [2] ベン
 ズアゼピン, インドロ [1, 2-e] [1, 5] ベンゾジアゾシン, インドロ [2
 , 1-b] [3] ベンズアゾシン等の4環式縮合ベンゼン環から水素原子を1個
 15 除去してできる基が挙げられる。

上記式



- [式中、各記号は前記と同意義を示す。] で表される基の具体例としては、1
 H-イミダゾ [1', 2' : 1, 2] ピリド [3, 4-b] インドール, 1H-イミ
 20 ダゾ [1', 2' : 1, 6] ピリド [4, 3-b] インドール, 1H-イミダゾ [1
 ', 5' : 1, 2] ピリド [3, 4-b] インドール, 1H-イミダゾ [1', 5'
 : 1, 6] ピリド [4, 3-b] インドール, 1H-ピリド [2', 1' : 2, 3]
 イミダゾ [4, 5-b] インドール, イミダゾ [4, 5-a] カルバゾール, イミ
 ダゾ [4, 5-c] カルバゾール, ピラゾロ [3, 4-c] カルバゾール, 2H-
 25 ピラジノ [1', 2' : 1, 5] ピロロ [2, 3-b] インドール, 1H-ピロロ [
 1', 2' : 1, 2] ピリミド [4, 5-b] インドール, 1H-インドリジノ [6
 , 7-b] インドール, 1H-インドリジノ [8, 7-b] インドール, インドロ
 [2, 3-b] インドール, インドロ [3, 2-b] インドール, ピロロ [2, 3-

- a) カルバゾール, ピロロ [2, 3-b] カルバゾール, ピロロ [2, 3-c] カルバゾール, ピロロ [3, 2-a] カルバゾール, ピロロ [3, 2-b] カルバゾール, ピロロ [3, 2-c] カルバゾール, ピロロ [3, 4-a] カルバゾール, ピロロ [3, 4-b] カルバゾール, ピロロ [3, 4-c] カルバゾール, 1H-ピリド [3', 4' : 4, 5] フロ [3, 2-b] インドール, 1H-フロ [3, 4-a] カルバゾール, 1H-フロ [3, 4-b] カルバゾール, 1H-フロ [3, 4-c] カルバゾール, 2H-フロ [2, 3-a] カルバゾール, 2H-フロ [2, 3-c] カルバゾール, 2H-フロ [3, 2-a] カルバゾール, 2H-フロ [3, 2-c] カルバゾール, 1H-ピリド [3', 4' : 4, 5] チエノ [2, 3-b] インドール, チエノ [3', 2' : 5, 6] チオピラノ [4, 3-b] インドール, チエノ [3', 4' : 5, 6] チオピラノ [4, 3-b] インドール, 1H- [1] ベンゾチエノ [2, 3-b] インドール, 1H- [1] ベンゾチエノ [3, 2-b] インドール, 1H-チエノ [3, 4-a] カルバゾール, 2H-チエノ [2, 3-b] カルバゾール, 2H-チエノ [3, 2-a] カルバゾール, 2H-チエノ [3, 2-b] カルバゾール, シクロペンタ [4, 5] ピロロ [2, 3-f] キノキサリン, シクロペンタ [5, 6] ピリド [2, 3-b] インドール, ピリド [2', 3' : 3, 4] シクロペンタ [1, 2-b] インドール, ピリド [2', 3' : 4, 5] シクロペンタ [1, 2-b] インドール, ピリド [3', 4' : 3, 4] シクロペンタ [1, 2-b] インドール, ピリド [3', 4' : 4, 5] シクロペンタ [1, 2-b] インドール, ピリド [4', 3' : 4, 5] シクロペンタ [1, 2-b] インドール, 1H-シクロペンタ [5, 6] ピラノ [2, 3-b] インドール, 1H-シクロペンタ [5, 6] チオピラノ [4, 3-b] インドール, シクロペンタ [a] カルバゾール, シクロペンタ [c] カルバゾール, インデノ [1, 2-b] インドール, インデノ [2, 1-b] インドール, [1, 2, 4] トリアジノ [4', 3' : 1, 2] ピリド [3, 4-b] インドール, 1, 3, 5-トリアジノ [1', 2' : 1, 1] ピリド [3, 4-b] インドール, 1H- [1, 4] オキサジノ [4', 3' : 1, 2] ピリド [3, 4-b] インドール, 1H- [1, 4] オキサジノ [4', 3' : 1, 6] ピリド [3, 4-b] インドール, 4H- [1, 3] オキサジノ [3', 4' : 1, 2] ピリド [3, 4-b] インドール, インドロ [3, 2-b] [1, 4] ベンズオキサジン, 1, 3-オキサジノ [6, 5-b] カルバゾール

ル, 2H-ピリミド〔2', 1': 2, 3〕〔1, 3〕チアジノ〔5, 6-b〕イン
 ドール, 2H-〔1, 3〕チアジノ〔3', 2': 1, 2〕ピリド〔3, 4-b〕イン
 ドール, 4H-〔1, 3〕チアジノ〔3', 4': 1, 2〕ピリド〔3, 4-b〕
 インドール, インドロ〔2, 3-b〕〔1, 4〕ベンゾチアジン, インドロ〔3,
 5 2-b〕〔1, 4〕ベンゾチアジン, インドロ〔3, 2-c〕〔2, 1〕ベンゾチア
 ジン, 1, 4-チアジノ〔2, 3-a〕カルバゾール, 〔1, 4〕チアジノ〔2,
 3-b〕カルバゾール, 〔1, 4〕チアジノ〔2, 3-c〕カルバゾール, 1, 4-
 チアジノ〔3, 2-b〕カルバゾール, 1, 4-チアジノ〔3, 2-c〕カルバゾー
 ル, 1H-インドロ〔2, 3-g〕プテリジン, 1H-インドロ〔3, 2-g〕プ
 10 テリジン, ピラジノ〔1', 2': 1, 2〕ピリド〔3, 4-b〕インドール, ピラ
 ジノ〔1', 2': 1, 2〕ピリド〔4, 3-b〕インドール, 1H-ピリド〔2',
 3': 5, 6〕ピラジノ〔2, 3-b〕インドール, 1H-ピリド〔3', 2':
 5, 6〕ピラジノ〔2, 3-b〕インドール, 1H-ピリド〔3', 4': 5, 6〕
 ピラジノ〔2, 3-b〕インドール, ピリド〔1', 2': 1, 2〕ピリミド〔4,
 15 5-b〕インドール, ピリド〔1', 2': 1, 2〕ピリミド〔5, 4-b〕インド
 ール, ピリド〔2', 1': 2, 3〕ピリミド〔4, 5-b〕インドール, ピリミド
 〔1', 2': 1, 2〕ピリド〔3, 4-b〕インドール, ピリミド〔1', 2': 1,
 6〕ピリド〔3, 4-b〕インドール, ピリミド〔5', 4': 5, 6〕ピラノ〔
 2, 3-b〕インドール, ピリダジノ〔4', 5': 5, 6〕チオピラノ〔4, 5-b
 20 〕インドール, 1H-インドロ〔3, 2-c〕シンノリン, 1H-インドロ〔2,
 3-b〕キノキサリン, 1H-ピラジノ〔2, 3-a〕カルバゾール, 1H-ピラ
 ジノ〔2, 3-b〕カルバゾール, 1H-ピラジノ〔2, 3-c〕カルバゾール,
 1H-ピリダジノ〔3, 4-c〕カルバゾール, 1H-ピリダジノ〔4, 5-b〕
 カルバゾール, 1H-ピリミド〔4, 5-a〕カルバゾール, 1H-ピリミド〔
 25 4, 5-c〕カルバゾール, 1H-ピリミド〔5, 4-a〕カルバゾール, 1H-
 ピリミド〔5, 4-b〕カルバゾール, 1H-ピリミド〔5, 4-c〕カルバゾー
 ル, 7H-1, 4-ジオキシノ〔2', 3': 5, 6〕〔1, 2〕ジオキシノ〔3,
 4-b〕インドール, 6H-〔1, 4〕ベンゾジオキシノ〔2, 3-b〕インドー
 ル, 6H-〔1, 4〕ベンゾジチイノ〔2, 3-b〕インドール, 1H-インドロ
 30 〔2, 3-b〕-1, 5-ナフチリジン, 1H-インドロ〔2, 3-b〕〔1, 6〕

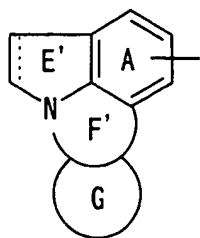
- ナフチリジン, 1H-インドロ〔2, 3-b〕〔1, 8〕ナフチリジン, 1H-インドロ〔2, 3-c〕-1, 5-ナフチリジン, 1H-インドロ〔2, 3-c〕〔1, 6〕ナフチリジン, 1H-インドロ〔2, 3-c〕〔1, 7〕ナフチリジン, 1H-インドロ〔2, 3-c〕〔1, 8〕ナフチリジン, 1H-インドロ〔3, 2-b〕
- 5〕-1, 5-ナフチリジン, 1H-インドロ〔3, 2-b〕〔1, 7〕ナフチリジン, 1H-インドロ〔3, 2-b〕〔1, 8〕ナフチリジン, 1H-インドロ〔3, 2-c〕〔1, 8〕ナフチリジン, インドロ〔2, 3-a〕キノリジン, インドロ〔2, 3-b〕キノリジン, インドロ〔3, 2-a〕キノリジン, インドロ〔3, 2-b〕キノリジン, ピラノ〔4', 3': 5, 6〕ピリド〔3, 4-b〕インドール, ピリド〔4', 3': 4, 5〕ピラノ〔3, 2-b〕インドール, ピリド〔4', 3': 5, 6〕ピラノ〔2, 3-b〕インドール, ピリド〔4', 3': 5, 6〕ピラノ〔3, 4-b〕インドール, 1H-インドロ〔2, 3-c〕イソキノリン, 1H-インドロ〔3, 2-c〕イソキノリン, 1H-インドロ〔2, 3-c〕キノリン, 1H-インドロ〔3, 2-c〕キノリン, 1H-ピリド〔2, 3-a〕カルバ
- 15ゾール, 1H-ピリド〔2, 3-b〕カルバゾール, 1H-ピリド〔2, 3-c〕カルバゾール, 1H-ピリド〔3, 2-a〕カルバゾール, 1H-ピリド〔3, 2-b〕カルバゾール, 1H-ピリド〔3, 2-c〕カルバゾール, 1H-ピリド〔3, 4-a〕カルバゾール, 1H-ピリド〔3, 4-b〕カルバゾール, 1H-ピリド〔3, 4-c〕カルバゾール, 1H-ピリド〔4, 3-a〕カルバゾール, 1H-ピリド〔4, 3-b〕カルバゾール, 1H-ピリド〔4, 3-c〕カルバゾール, 1H-キンドリン, 1H-キニンドリン, 1H-ピラノ〔3', 4': 5, 6〕ピラノ〔4, 3-b〕インドール, 〔1〕ベンゾピラノ〔2, 3-b〕インドール, 〔1〕ベンゾピラノ〔3, 2-b〕インドール, 〔1〕ベンゾピラノ〔3, 4-b〕インドール, 〔1〕ベンゾピラノ〔4, 3-b〕インドール, 〔2〕ベンゾピ
- 25ラノ〔4, 3-b〕インドール, ピラノ〔2, 3-a〕カルバゾール, ピラノ〔2, 3-b〕カルバゾール, ピラノ〔2, 3-c〕カルバゾール, ピラノ〔3, 2-a〕カルバゾール, ピラノ〔3, 2-c〕カルバゾール, ピラノ〔3, 4-a〕カルバゾール, 1H-ホスフィノリノ〔4, 3-b〕インドール, 〔1〕ベンゾチオピラノ〔2, 3-b〕インドール, 〔1〕ベンゾチオピラノ〔3, 2-b〕インドール, 〔1〕ベンゾチオピラノ〔3, 4-b〕インドール, 〔1〕ベンゾチオピ
- 30

- ラノ〔4, 3-b〕インドール, 〔2〕ベンゾチオピラノ〔4, 3-b〕インドール, 1H-ベンゾ〔a〕カルバゾール, 1H-ベンゾ〔b〕カルバゾール, 1H-ベンゾ〔c〕カルバゾール, 〔1, 6, 2〕オキサチアゼピノ〔2', 3': 1, 2〕ピリド〔3, 4-b〕インドール, 1H-アゼピノ〔1', 2': 1, 2〕ピリド〔3, 4-b〕インドール, 1H-ピリド〔1', 2': 1, 2〕アゼピノ〔4, 5-b〕インドール, 2H-ピリド〔1', 2': 1, 2〕アゼピノ〔3, 4-b〕インドール, 1H-ピリド〔3', 2': 5, 6〕オキセピノ〔3, 2-b〕インドール, 1H-ピリド〔4', 3': 5, 6〕オキセピノ〔3, 2-b〕インドール, 2H-ピリド〔2', 3': 5, 6〕オキセピノ〔2, 3-b〕インドール, 2H-ピリド〔2', 3': 5, 6〕オキセピノ〔3, 2-b〕インドール, 2H-ピリド〔3', 4': 5, 6〕オキセピノ〔3, 2-b〕インドール, ピリド〔2', 3': 4, 5〕シクロヘプタ〔1, 2-b〕インドール, ピリド〔3', 2': 3, 4〕シクロヘプタ〔1, 2-b〕インドール, ピリド〔3', 4': 4, 5〕シクロヘプタ〔1, 2-b〕インドール, ピリド〔3', 4': 5, 6〕シクロヘプタ〔1, 2-b〕インドール, 2H-ピラノ〔3', 2': 2, 3〕アゼピノ〔4, 5-b〕インドール, 1H-インドロ〔3, 2-b〕〔1, 5〕ベンズオキサゼピン, 1H-インドロ〔3, 2-d〕〔1, 2〕ベンズオキサゼピン, 1H-インドロ〔2, 3-c〕〔1, 5〕ベンゾチアゼピン, 〔1, 4〕ジアゼピノ〔2, 3-a〕カルバゾール, インドロ〔2, 3-b〕〔1, 5〕ベンゾジアゼピン, インドロ〔2, 3-d〕〔1, 3〕ベンゾジアゼピン, インドロ〔3, 2-b〕〔1, 4〕ベンゾジアゼピン, インドロ〔3, 2-b〕〔1, 5〕ベンゾジアゼピン, インドロ〔3, 2-d〕〔1, 3〕ベンゾジアゼピン, インドロ〔3, 2-d〕〔2, 3〕ベンゾジアゼピン, インドロ〔2, 3-a〕〔3〕ベンズアゼピン, インドロ〔2, 3-c〕〔1〕ベンズアゼピン, インドロ〔2, 3-d〕〔1〕ベンズアゼピン, インドロ〔2, 3-d〕〔2〕ベンズアゼピン, インドロ〔3, 2-b〕〔1〕ベンズアゼピン, インドロ〔3, 2-c〕〔1〕ベンズアゼピン, インドロ〔3, 2-d〕〔1〕ベンズアゼピン, 1H-インドロ〔2, 1-b〕〔3〕ベンズアゼピン, 1H-〔1〕ベンズオキセピノ〔5, 4-b〕インドール, 1H-〔2〕ベンズオキセピノ〔4, 3-b〕インドール, 1H-〔1〕ベンゾチエピノ〔4, 5-b〕インドール, 1H-〔1〕ベンゾチエピノ〔5, 4-b〕インドール, ベンゾ〔

- 3, 4] シクロヘプタ [1, 2-b] インドール, ベンゾ [4, 5] シクロヘプタ
[1, 2-b] インドール, ベンゾ [5, 6] シクロヘプタ [1, 2-b] インドール,
ベンゾ [6, 7] シクロヘプタ [1, 2-b] インドール, シクロヘプタ [b]
カルバゾール, 4H- [1, 5] オキサゾシノ [5', 4' : 1, 6] ピリド [3, 4-b]
5 3, 4-b] インドール, アゾシノ [1', 2' : 1, 2] ピリド [3, 4-b] インドール,
2, 6-メタノ-2H-アゼシノ [4, 3-b] インドール, 3, 7-メタノ-3H-アゼシノ [5, 4-b] インドール, ピリド [1', 2' : 1, 8] ア
ゾシノ [5, 4-b] インドール, ピリド [4', 3' : 6, 7] オキサシノ [2, 3-b] インドール,
ピリド [4', 3' : 6, 7] オキサシノ [4, 3-b] イ
10 ドール, 1, 5-メタノ-1H-アゼシノ [3, 4-b] インドール, 2, 6-メ
タノ-1H-アゼシノ [5, 4-b] インドール, 1H-ピリド [3', 4' : 5, 6] シクロオクタ [1, 2-b] インドール,
1, 4-エタノオキサシノ [3, 4-b] インドール, ピラノ [3', 4' : 5, 6] シクロオクタ [1, 2-b] イ
ンドール, 1H-インドロ [2, 3-c] [1, 2, 5, 6] ベンゾテトラゾシン, 1
15 H-インドロ [2, 3-c] [1, 6] ベンゾジアゾシン, 6, 13b-メタノ-
13bH-アゼシノ [5, 4-b] インドール, オキサシノ [3, 2-a] カルバ
ゾール, 1H-ベンゾ [g] シクロオクタ [b] インドール, 6, 3- (イミノメ
タノ) -2H-1, 4-チアゾニノ [9, 8-b] インドール, 1H, 3H- [1, 4] オキサ
ゾニノ [4', 3' : 1, 2] ピリド [3, 4-b] インドール, 2H-
20 3, 6-エタノアゾニノ [5, 4-b] インドール, 2H-3, 7-メタノアザシ
クロウンデシノ [5, 4-b] インドール, 1H-6, 12b-エタノアゾニノ [5, 4-b] イ
ンドール, インドロ [3, 2-e] [2] ベンズアゾニン, 5, 9-メ
タノアザシクロウンデシノ [5, 4-b] インドール, 3, 6-エタノ-3H-
アゼシノ [5, 4-b] インドール, 3, 7-メタノ-3H-アザシクロウンデ
25 シノ [5, 4-b] インドール, ピラノ [4', 3' : 8, 9] アゼシノ [5, 4-b]
] インドール, 1H-インドロ [2, 3-c] [1, 7] ベンゾジアゼシン, 1H-
インドロ [3, 2-e] [2] ベンズアゼシン, ベンゾ [e] ピロロ [3, 2-b]
] インドール, ベンゾ [e] ピロロ [3, 2-g] インドール, ベンゾ [e] ピ
ロロ [3, 2, 1-hi] インドール, ベンゾ [e] ピロロ [3, 4-b] インドール,
30 ベンゾ [g] ピロロ [3, 4-b] インドール, 1H-ベンゾ [f] ピロロ [1,

- 2-a) インドール, 1H-ベンゾ [g] ピロロ [1, 2-a) インドール, 2H-
ベンゾ [e] ピロロ [1, 2-a) インドール, 1H-ベンゾ [f] ピロロ [2,
1-a) イソインドール, 1H-ベンゾ [g] ピロロ [2, 1-a) イソインドール,
2H-ベンゾ [e] ピロロ [2, 1-a) イソインドール, イソインドロ [6
5 , 7, 1-cde) インドール, スピロ [シクロヘキサン-1, 5'-[5H] ピロロ
[2, 1-a) イソインドール], イソインドロ [7, 1, 2-hij] キノリン, 7,
11-メタノアゾシノ [1, 2-a) インドール, 7, 11-メタノアゾシノ [2,
1-a) イソインドール, ジベンズ [cd, f] インドール, ジベンズ [cd, g]
インドール, ジベンズ [d, f] インドール, 1H-ジベンズ [e, g] インドール
10 , 1H-ジベンズ [e, g] イソインドール, ナフト [1, 2, 3-cd) インドール,
ナフト [1, 8-ef) インドール, ナフト [1, 8-fg) インドール, ナフト
[3, 2, 1-cd) インドール, 1H-ナフト [1, 2-e) インドール, 1H-
ナフト [1, 2-f) インドール, 1H-ナフト [1, 2-g) インドール, 1H-
ナフト [2, 1-e) インドール, 1H-ナフト [2, 3-e) インドール, 1
15 H-ナフト [1, 2-f) イソインドール, 1H-ナフト [2, 3-e) イソイン
ドール, スピロ [1H-カルバゾール-1, 1'-シクロヘキサン], スピロ [2H-
カルバゾール-2, 1'-シクロヘキサン], スピロ [3H-カルバゾール-3, 1'-
シクロヘキサン], シクロヘプタ [4, 5] ピロロ [3, 2-f) キ
ノリン, シクロヘプタ [4, 5] ピロロ [3, 2-h) キノリン, アゼピノ [4,
20 5-b) ベンズ [e] インドール, 1H-アゼピノ [1, 2-a) ベンズ [f] イン
ドール, 1H-アゼピノ [2, 1-a) ベンズ [f] イソインドール, ベンゾ [e]
シクロヘプタ [b] インドール, ベンゾ [g] シクロヘプタ [b] インドール等
の4環式縮合ベンゼン環から水素原子を1個除去してできる基が挙げられる。

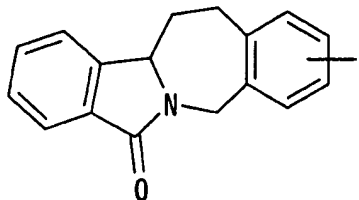
上記式



〔式中、各記号は前記と同意義を示す。〕で表される基の具体例としては、1

H-ジピロロ〔2, 3-b: 3', 2', 1'-hi〕インドール, スピロ〔シクロペンタン-1, 2' (1'H) -ピロロ〔3, 2, 1-hi〕インドール〕, スピロ〔イミダゾリジン-4, 1' (2'H) -〔4H〕ピロロ〔3, 2, 1-ij〕キノリン〕, ピリド〔2, 3-b〕ピロロ〔3, 2, 1-hi〕インドール, 5
 ール, ピリド〔4, 3-b〕ピロロ〔3, 2, 1-hi〕インドール, ベンゾ〔de〕ピロロ〔3, 2, 1-ij〕キノリン, 3H-ピロロ〔3, 2, 1-de〕アクリジン, 1H-ピロロ〔3, 2, 1-de〕フェナントリジン, スピロ〔シクロヘキサン-1, 6'-〔6H〕ピロロ〔3, 2, 1-ij〕キノリン〕, 4, 9-メタノピロロ〔3, 2, 1-lm〕〔1〕ベンゾアゾシン, ス
 10 ピロ〔シクロヘプタン-1, 6'-〔6H〕ピロロ〔3, 2, 1-ij〕キノリン〕, 1H-ピラノ〔3, 4-d〕ピロロ〔3, 2, 1-jk〕〔1〕ベンズアゼピン, 3H-ベンゾ〔b〕ピロロ〔3, 2, 1-jk〕〔4, 1〕ベンズオキサゼピン, 7H-インドロ〔1, 7-ab〕〔4, 1〕ベンズオキサゼピン, ベンゾ〔b〕ピロロ〔3, 2, 1-jk〕〔1, 4〕ベンゾジアゼピン,
 15 インドロ〔1, 7-ab〕〔1, 4〕ベンゾジアゼピン, インドロ〔1, 7-ab〕〔1〕ベンズアゼピン, インドロ〔7, 1-ab〕〔3〕ベンズアゼピン, 1H-シクロヘプタ〔d〕〔3, 2, 1-jk〕〔1〕ベンズアゼピン, スピロ〔アゼピノ〔3, 2, 1-hi〕インドール-7 (4H), 1'-シクロヘプタン〕, 4H-5, 11-メタノピロロ〔3, 2, 1-no〕〔1〕ベン
 20 ズアザシクロウンデシン, スピロ〔アゼピノ〔3, 2, 1-hi〕インドール-7 (4H), 1'-シクロオクタン〕等の4環式縮合ベンゼン環から水素原子を1個除去してできる基等が挙げられる。

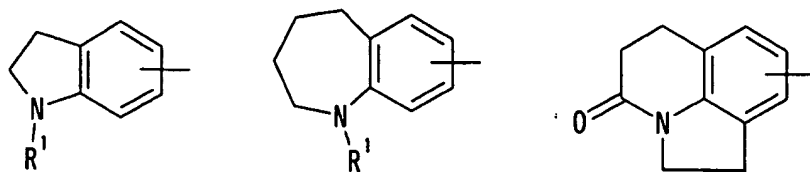
このうち、更に好ましくは、式



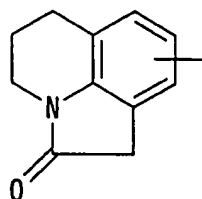
25 で表される基等である。

Arで示される「縮合していてもよいフェニル基で、該フェニル基は置換基を有していてもよい」として、好ましくは、例えば置換基を有していてもよい

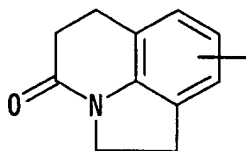
式



または



- 5 で表される基である。特に好ましくは、式



で表される基である。

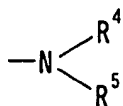
n は、好ましくは、1ないし6の整数である。更に好ましくは2ないし6である。特に好ましくは2である。

- 10 R は、水素原子又は置換基を有していてもよい炭化水素基を示し、n の繰り返しにおいて異なってもよい。

R で示される「置換基を有していてもよい炭化水素基」としては、R¹ で示される「置換基を有していてもよい炭化水素基」と同様のものが挙げられる。

R としては水素原子が好ましい。

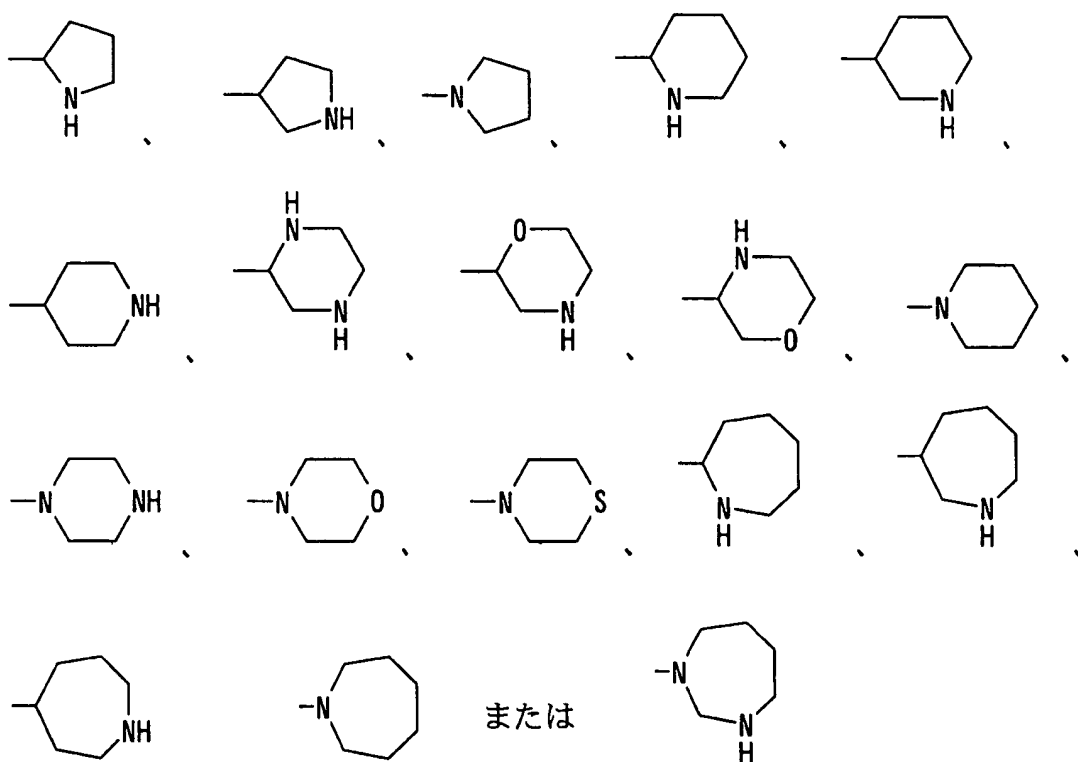
- 15 Y で示される「置換されていてもよいアミノ基」としては、例えば式



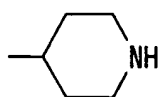
〔式中、R⁴ 及び R⁵ は、それぞれ水素原子、置換基を有していてもよい炭化水素基又はアシル基を示す。〕で表される基等が挙げられる。

R⁴又はR⁵で示される「置換基を有していてもよい炭化水素基」及び「アシル基」としては、R¹で示される「置換基を有していてもよい炭化水素基」及び「アシル基」と同様のものが挙げられる。

Yで示される「置換基を有していてもよい含窒素飽和複素環基」の「含窒素飽和複素環基」としては、炭素原子及び1個の窒素原子以外に、窒素原子、酸素原子及び硫黄原子から選ばれるヘテロ原子を1ないし3個含有していてもよい5 5ないし9員（好ましくは5ないし7員）含窒素飽和複素環基等が挙げられる。具体的には、式



10 で表される基等が挙げられる。このうち、好ましくは6員環基である。更に好ましくは

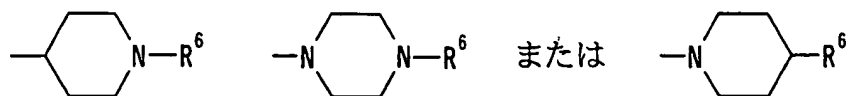


である。

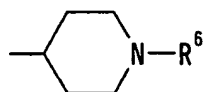
該「置換基を有していてもよい含窒素飽和複素環基」の「置換基」としては、上記B環で示される「置換基を有していてもよい複素環」の「置換基」と同様のものが挙げられ、その置換基数は1ないし5個である。また、該「置換基

を有していてもよい含窒素飽和複素環基」の「含窒素飽和複素環基」の窒素は、上記 R^1 で表される基と同様のものを有していてもよい。

Yとして、好ましくは式



- 5 〔式中、 R^6 は R^1 と同意義を示す。〕で表される基等である。更に好ましくは、式

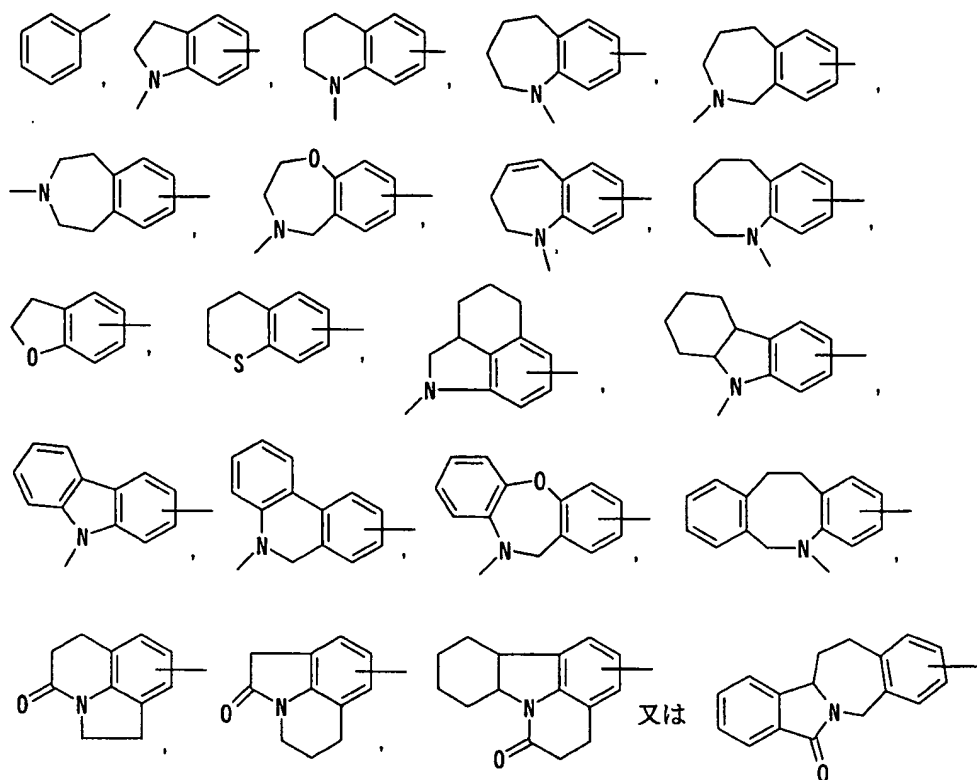


〔式中、 R^6 は前記と同意義を示す。〕で表される基等である。

- 10 R^6 は、好ましくは、水素原子又は置換基を有していてもよい炭化水素基である。更に好ましくは、ハロゲン原子（好ましくはフルオロ等）、 C_{1-6} アルキル（好ましくはメチル等）、 C_{1-6} アルコキシ（好ましくはメトキシ等）、シアノ、ニトロ及びヒドロキシから選ばれる置換基を1ないし3個有していてもよい C_{7-16} アラルキル基（好ましくはベンジル）等である。

化合物（I）として、好ましくは、Arが式

49



で表される基で、このうちArがフェニル基の場合、該フェニル基は①ハロゲン（フルオロ等）、②C₁₋₆アルコキシ（メトキシ等）、③アミノ、④（モノ又はジ）C₁₋₆アルキルアミノ（メチルアミノ、エチルアミノ、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ等）、⑤ピロリジノ、⑥ピペリジノ、⑦ピペラジノ、⑧N-メチルピペラジノ、⑨N-アセチルピペラジノ、⑩モルホリノ、⑪ヘキサメチレンイミノ、⑫イミダゾリル及び⑬C₁₋₆アルキル（メチル等）でエステル化されていてもよいカルボキシで置換されていてもよいC₁₋₆アルキル（プロピル等）から選ばれる置換基を有していてもよく、

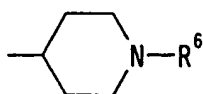
- 10 Arが縮合したフェニル基の場合、その複素環部分は①C₁₋₆アルキル（メチル、エチル、プロピル、n-ブチル等）、②ハロゲン（フルオロ、クロロ等）、C₁₋₆アルキル（メチル等）、C₁₋₆アルコキシ（メトキシ等）及びニトロから選ばれる置換基を有していてもよいC₇₋₁₆アラルキル（ベンジル、フェニルエチル等）、③C₁₋₆アルキル-カルボニル（アセチル、プロピオニル、イソブチリル、ピバロイル等）、④C₇₋₁₆アラルキル-カルボニル（フェニルアセチル等）、⑤C₆₋₁₄アリール-カルボニル（ベンゾイル等）、⑥C₁₋₆アルキル-カルボニル-C₆₋₁₄アリール（メチルベンゾイル等）、⑦C₁₋₆アルコキ
- 15

シーカルボニル- C_{6-14} アリール (メトキシベンゾイル等) 及び⑧ピリジルから選ばれる置換基を有していてもよく;

n が2;

R が水素原子;

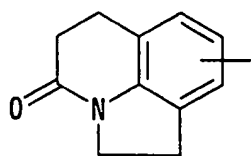
5 Y が式



〔式中の記号は前記と同意義を示す。〕で表される基で、

R^6 が①水素原子、②シアノ、ヒドロキシ、(モノ又はジ) C_{1-6} アルキルアミノ (ジエチルアミノ等)、ピリジル及び (C_{1-6} アルキル (エチル等) で) エステル化されていてもよいカルボキシから選ばれる置換基を有していてもよい C_{1-6} アルキル (メチル、エチル、イソプロピル等)、③ハロゲン (フルオロ、クロロ等)、 C_{1-6} アルキル (メチル、 t -ブチル等)、ハロゲン C_{1-6} アルキル (トリフルオロメチル等)、ヒドロキシ、 C_{1-6} アルコキシ (メトキシ等)、ニトロ、アミノ、シアノ、カルバモイル、(C_{1-6} アルキル等で) エステル化されていてもよいカルボキシで置換されていてもよい C_{1-6} アルコキシ (OCH_2CO_2H 、 OCH_2CO_2Et 等)、 C_{1-6} アルキルで置換されていてもよいカルバモイル又はホルミルで置換されていてもよいアミノ ($NHCHO$ 、 $NHCONH_2$ 、 $NHCONHMe$ 等) 及び C_{1-3} アルキレンジオキシ (メチレンジオキシ等) から選ばれる置換基を有していてもよい C_{7-16} アラールキル (ベンジル、 α -メチルベンジル、フェニルエチル等)、④ (C_{1-6} アルキル (エチル等) 等で) エステル化されていてもよいカルボキシで置換されていてもよい C_{1-6} アルキル (メチル、プロピル等) 又は⑤ (モノ又はジ) C_{1-6} アルキルアミノ (ジメチルアミノ等) で置換されていてもよい C_{1-6} アルキル-カルボニル (アセチル等) である化合物等が挙げられる。

25 化合物 (I) として、更に好ましくは、 Ar が式

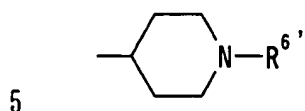


で表される基；

nが2；

Rが水素原子；

Yが式



〔式中、 $R^{6'}$ はハロゲン原子、 C_{1-3} アルキル、 C_{1-3} アルコキシ、シアノ、ニトロ及びヒドロキシから選ばれる置換基を1又は2個有していてもよいベンジルを示す。〕で表される基である化合物等が挙げられる。

特に好ましくは、8-[3-[1-[(3-フルオロフェニル)メチル]-4-ピペリジニル]-1-オキソプロピル]-1,2,5,6-テトラヒドロ-4H-ピロロ[3,2,1-ij]キノリン-4-オン、

8-[3-[1-(フェニルメチル)-4-ピペリジニル]-1-オキソプロピル]-1,2,5,6-テトラヒドロ-4H-ピロロ[3,2,1-ij]キノリン-4-オン、

15 8-[3-[1-[(2-ヒドロキシフェニル)メチル]-4-ピペリジニル]-1-オキソプロピル]-1,2,5,6-テトラヒドロ-4H-ピロロ[3,2,1-ij]キノリン-4-オン、又はその塩等が挙げられる。

化合物(I)又はその塩は自体公知の方法又はそれに準じた方法によって製造することができる。具体的には、上記式中、

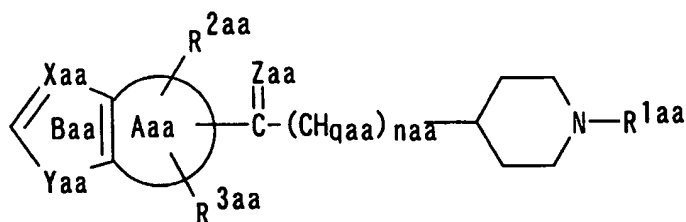
20 (1) Arで示される「縮合していてもよいフェニル基で、該フェニル基は置換基を有していてもよい」が縮合環を形成しない場合、特開平3-173867号(EP-A-0378207号)、特開昭64-79151号(EP-A-0296560号)記載の方法等、

25 (2) Arで示される「縮合していてもよいフェニル基で、該フェニル基は置換基を有していてもよい」が置換基を有していてもよい単環式複素環と縮合する場合、特開平5-140149号(EP-A-0487071号)、特開平6-166676号(EP-A-0560235号)、特開平6-206875号(EP-A-0567090号)、特開平2-169569号(USP 4,895,841号)記載の方法等、

(3) Arで示される「縮合していてもよいフェニル基で、該フェニル基は置換基を有していてもよい」が置換基を有していてもよい2環式複素環と縮合する場合、あるいは2つの同一又は異なった単環（但し、少なくとも一方の環が単環式複素環である）と縮合する場合、特開平7-206854号（EP-A-0607864号）記載の方法等、及び

(4) Arで示される「縮合していてもよいフェニル基で、該フェニル基は置換基を有していてもよい」が置換基を有していてもよい3環式複素環と縮合する場合、特開平7-309835（EP-A-0655451号）記載の方法等に準じて目的物を製造すればよい。

10 2) 式

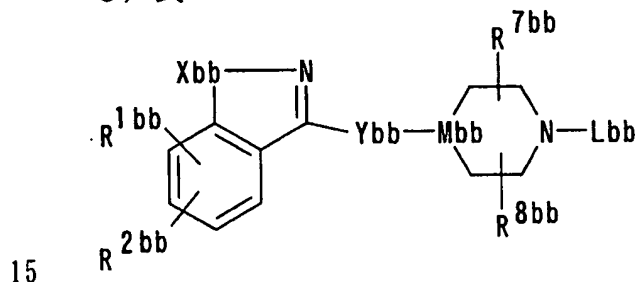


〔式中、C=Zaaを含む側鎖、R^{2aa}あるいはR^{3aa}のうちひとつは、環Baaの*で示した炭素原子に結合し、環Aaaはベンゾ、チエノ、ピリド、ピラジノ、ピリミド、フラノ、セレノ、ピロロ、チアゾロあるいはイミダゾロを示し、R^{1aa}はフェニル、フェニル-C₁₋₆アルキル、シンナミル又はヘテロアリールメチル（ここでヘテロアリール基としては、イミダゾロ、チアゾロ、チエノ、ピリド又はイソオキサゾロを示す）を示し、フェニル及びヘテロアリール基はC₁₋₆アルキル、C₁₋₆アルコキシ及びハロゲンから選ばれる置換基を1〜2個有していてもよい。R^{2aa}及びR^{3aa}は、それぞれ独立して、水素原子、C₁₋₆アルコキシ、1〜3個のフッ素で置換されていてもよいC₁₋₆アルキル基、ベンジルオキシ、ヒドロキシ、フェニル、ベンジル、ハロゲン、ニトロ、シアノ、COOR^{4aa}、CONHR^{4aa}、NR^{4aa}R^{5aa}、NR^{4aa}COR^{5aa}又はSO_{paa}CH₂Ph（ここでpaaは0、1又は2を示す）を示すか、R^{2aa}とR^{3aa}は隣接する炭素原子と共に5ないし6員環（環の構成原子は、炭素、窒素、酸素）、例えばメチレンジオキシ、エチレンジオキシあるいはラクタム環を形成してもよい。また、R^{4aa}及びR^{5aa}はそれぞれ独立して、水素原子又はC₁₋₆アルキル基を示すか、NR^{4aa}R^{5aa}のR^{4aa}及びR^{5aa}は隣接する窒素原子と共に窒素原子を少なくとも1個含む4ないし8員環（環の他の構成原子は炭素、酸素又は窒素である。）を形成してもよい。またNR^{4aa}COR^{5aa}のR^{4aa}及びR^{5aa}は隣接する窒素原子及び炭素原子と共に4ないし

8員ラクタム環を形成してもよい。Xaaは窒素あるいはCHを、Yaaは酸素、イオウあるいはNR^{6aa}を示す。R^{6aa}は水素原子、C₁₋₆アルキル、CO-C₁₋₆アルキルあるいはSO₂-フェニル(ここで、フェニル基はC₁₋₄アルキルから独立して選ばれる1ないし5個の置換基を有していてもよい)を示す。naaは1ないし4の整数を、それぞれのqaaは独立して1ないし2を、Zaaは酸素あるいはイオウを示す。)で表される化合物又はその塩。具体例としては、1-(2-メチル-1H-ベンズイミダゾール-5-イル)-3-[1-(フェニルメチル)-4-ピペリジニル]-1-プロパノン、1-(6-メチルベンゾ[b]チエ-2-イル)-3-[1-(フェニルメチル)-4-ピペリジニル]-1-プロパノン、1-(6-メチルインドール-2-イル)-3-[1-(フェニルメチル)-4-ピペリジニル]-1-プロパノン等が挙げられる。

上記化合物又はその塩は、WO 93/07140記載の方法又はそれに準じた方法により製造される。

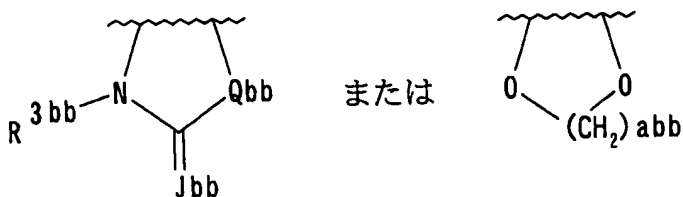
3) 式



[式中、R^{1bb}及びR^{2bb}はそれぞれ、水素原子、C₁₋₆アルコキシ、ベンジロキシ、フェノキシ、ヒドロキシ、フェニル、ベンジル、ハロゲン、ニトロ、シアノ、式: COR^{5bb}、-COOR^{5bb}、-CONHR^{5bb}、-NR^{5bb}R^{6bb}又は-NR^{5bb}COR^{6bb}(式中、R^{5bb}及びR^{6bb}はそれぞれ i) 水素原子、ii) C₁₋₆アルキル、iii) ハロゲン、C₁₋₄アルキル、トリフルオロメチル、C₁₋₄アルコキシ、シアノ、ニトロ及びヒドロキシから選ばれる置換基を1又は2個それぞれ有していてもよいフェニル又はベンジル; 又は NR^{5bb}R^{6bb}のR^{5bb}とR^{6bb}とは一緒になって4ないし8員含窒素環を形成、NR^{5bb}COR^{6bb}のR^{5bb}とR^{6bb}とは一緒になって4ないし8員ラクタム環

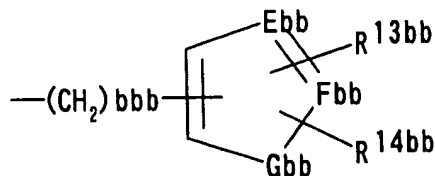
を形成する) で表される基、1ないし3個のフッ素で置換されていてもよい C_{1-6} アルキル、式: $SO_{pbb}CH_2$ -フェニル 又は $SO_{pbb}C_{1-6}$ アルキル (式中、

- 5 pbb は0、1又は2を示す) で表される基、ピリジルメチルオキシ、チエニルメチルオキシ、2-オキサゾリル、2-チアゾリル又はベンゼンスルホンアミド (該フェノキシ、ベンジルオキシ、フェニル、ベンジル、ベンゼンスルホンアミド、ピリジルメチルオキシ、チエニルメチルオキシ、2-オキサゾリル、2-チアゾリルは、ハロゲン、 C_{1-6} アルキル、トリフルオロメチル、 C_{1-6} アルコキシ、シアノ、ニトロ及びヒドロキシから選ばれる置換基を1又は2
- 10 個を有していてもよい) ; 又は
- R^{1bb} 及び R^{2bb} は隣接する炭素原子に結合する場合及び X_{bb} が酸素、硫黄又は NR^{4bb} (R^{4bb} は、水素又は C_{1-4} アルキルである) である場合、これらが結合する炭素原子と一緒に式



- 15 [式中、 J_{bb} は酸素、硫黄又は NR^{4bb} 、 a_{bb} は1又は2、 R^{3bb} は水素又は C_{1-6} アルキル、 Q_{bb} は酸素、硫黄、NH、 $CHCH_3$ 、 $C(CH_3)_2$ 、 $-CH=CH-$ 又は $(CH_2)_{1bb}$ 、及び
- 20 l_{bb} は1ないし3の整数を示す。] で表される基を形成；
- X_{bb} は酸素、硫黄、 $-CH=CH-$ 、 $-CH=N-$ 、 $-NH=CH-$ 、 $-N=N-$ 又は NR^{4bb} (R^{4bb} は前記と同意義) ；
- Y_{bb} は $-(CH_2)_{m_{bb}}-$ 、 $-CH=CH(CH_2)_{n_{bb}}-$ 、 $-NR^{4bb}(CH_2)_{m_{bb}}-$ 又は $-O(CH_2)_{m_{bb}}-$ (R^{4bb} は前記と同意義、 n_{bb} は0ないし3の
- 25 整数、 m_{bb} は1ないし3の整数；
- M_{bb} は $-CH-$ 又は窒素；
- L_{bb} は i) ハロゲン、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} アルコキシ-

カルボニル又は C_{1-6} アルキル-カルボニルから選ばれる置換基を1ないし3個それぞれ有していてもよいフェニル又はフェニル- C_{1-6} アルキル、ii) シンナミル、iii) ピリジルメチル、又はiv) 式：



5 [式中、bbbは1ないし4の整数、

R^{13bb} 及び R^{14bb} はそれぞれ水素、 C_{1-4} アルキル、ハロゲン又はフェニル、Ebb及びFbbはそれぞれ-CH-又は窒素、

Gbbは酸素、硫黄又は NR^{4bb} (R^{4bb} は前記と同意義)を示す。但し、Ebb及びFbbが両者とも窒素の場合、 R^{13bb} 及び R^{14bb} の一方は存在せず。]

10 で表される基；

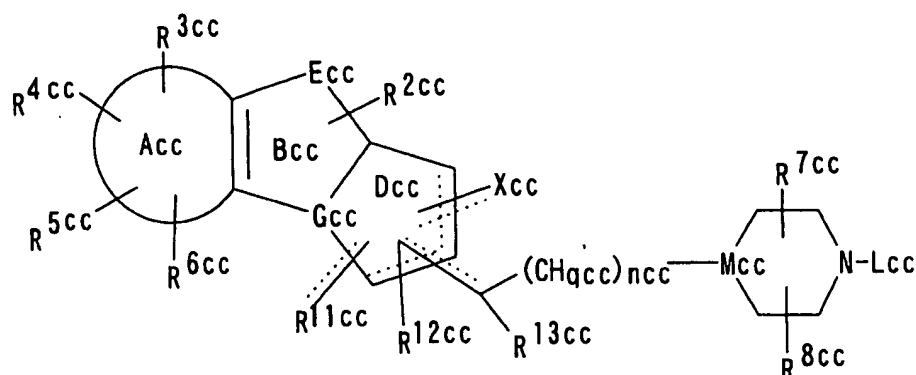
R^{7bb} 及び R^{8bb} はそれぞれ水素、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アルコキシ-カルボニル、 C_{1-6} アルキル-カルボニル又は C_{1-6} アルコキシを示す。但し、該 C_{1-6} アルコキシは窒素に隣接する炭素原子には結合しない。) で表される化合物又はその塩。具体例としては、3-[2-[1-(フェニルメチル)-4-ピ

15 ペリジニル]エチル]-5,6,8-トリヒドロ-7H-イソキサゾロ[4,5-g]キノリン-7-オン、6,8-ジヒドロ-3-[2-[1-(フェニルメチル)-4-ピペリジニル]エチル]-7H-ピロロ[5,4-g]-1,2-ベンズイソキサゾール-7-オン、5,7-ジヒドロ-3-[2-[1-(フェニルメチル)-4-ピペリル]エチル]-6H-ピロロ[5,4-f]-1

20 , 2-ベンズイソキサゾール-6-オン等が挙げられる。

上記化合物又はその塩は、特表平6-500794号公報(WO 92/17475)記載の方法又はそれに準じた方法により製造される。

4) 式



- 〔式中、環A_{cc}はベンゾ、チエノ、ピリド、ピラジノ、ピリミド、フラノ、セ
レノロ又はピロロ；
- R^{2cc}は水素、C₁₋₄アルキル、ベンジル、フルオロ又はシアノ；
- 5 R^{3cc}、R^{4cc}、R^{5cc}及びR^{6cc}はそれぞれ、水素、C₁₋₆アルコキシ、ベン
ジルオキシ、フェノキシ、ヒドロキシ、フェニル、ベンジル、ハロゲン、ニト
ロ、シアノ、-COOR^{9cc}、-CONHR^{9cc}、-NR^{9cc}R^{10cc}、-NR^{9cc}
COR^{10cc}、又は1ないし3個のフッ素原子で置換されていてもよいC₁₋₆
アルキル；SO_{pcc}CH₂-フェニル（p_{cc}は0、1又は2）、ピリジルメチ
10 ルオキシ又はチエニルメチルオキシ（該フェノキシ、ベンジルオキシ、フェニ
ル、ピリジルメチルオキシ及びチエニルメチルオキシは、ハロゲン、C₁₋₄ア
ルキル、トリフルオロメチル、C₁₋₄アルコキシ、シアノ、ニトロ及びヒドロ
キシから選ばれる置換基を1又は2個有していてもよい）；又は
- R^{3cc}、R^{4cc}、R^{5cc}及びR^{6cc}の2つは、隣接する炭素原子と一緒にあって
15 、該隣接炭素原子と共に環の各原子が炭素、窒素又は酸素である飽和5又は6
員環（例えば、メチレンジオキシ、エチレンジオキシ又はラクタム環）を形成
；
- R^{9cc}及びR^{10cc}はそれぞれ水素又はC₁₋₆アルキル、又は
NR^{9cc}R^{10cc}のR^{9cc}及びR^{10cc}は一緒にあって環の1つの原子が窒素で
20 あり、他が炭素である4ないし8員環状アミノ基を形成、又は
NR^{9cc}COR^{10cc}のR^{9cc}及びR^{10cc}は、一緒にあって4ないし8員環状ラ
クタム環を形成；
- G_{cc}は炭素又は窒素；
- E_{cc}は炭素、窒素、酸素、硫黄、スルホキシド又はスルホン；

--- は単結合又は二重結合；

環D cc の1-、2-又は3-位のいずれかにある炭素がカルボニル基に隣接している場合、適宜窒素で置換されていてもよい（該炭素は環D cc の1-、2-又は3-位にあるため環はラクタム環となる）；

- 5 X cc はO、S、NOR^{1cc}、水素又はC₁₋₆アルキル（但し、X cc が結合している環D cc の原子が炭素であり、X cc がO、S、NOR^{1cc}であるときのみ、X cc は環D cc に二重結合する）；

R^{1cc}は水素又はC₁₋₆アルキル；

q cc は1又は2；

- 10 環D cc がラクタム環の場合、n cc は1ないし3の整数、環D cc がラクタム環ではない場合、n cc は0又は1ないし3の整数；

M cc は炭素又は窒素；

- 15 L cc はフェニル、フェニル-C₁₋₆アルキル、シンナミル又はピリジルメチル（該フェニル及びフェニル-C₁₋₆アルキルは、C₁₋₆アルキル、C₁₋₆アルコキシ、C₁₋₆アルコキシ-カルボニル、C₁₋₆アルキル-カルボニル及びハロゲンから選ばれる置換基を1ないし3個有していてもよい）；

R^{11cc}は水素、ハロゲン、ヒドロキシ、C₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルコキシ又は酸素；

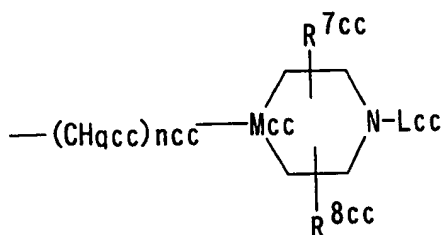
- 20 R^{12cc}及びR^{13cc}はそれぞれ、水素、フルオロ、ヒドロキシ、アセトキシ、
o-メシレート、o-トシレート、C₁₋₄アルキル又はC₁₋₄アルコキシ；又は
R^{12cc}及びR^{13cc}の両者が炭素原子に結合している場合、それらが結合している原子と一緒に環の各原子が炭素又は酸素である3ないし5員環を形成；

- 25 R^{7cc}及びR^{8cc}はそれぞれ、水素、C₁₋₆アルキル又はC₁₋₆アルコキシ（該C₁₋₆アルコキシは、窒素、C₁₋₆アルコキシ-カルボニル及びC₁₋₆アルキル-カルボニルに隣接している炭素とは結合しない）；又は

R^{8cc}及びR^{12cc}はそれらが結合している原子と一緒に4ないし7員飽和炭素環を形成する（前記炭素原子の1つは、酸素、窒素又は硫黄で置換されていてもよい）。

- 30 但し、(a) E cc が炭素、窒素、酸素、硫黄、スルホキシド又はスルホンの場合

- 合、G cc は炭素であり；(b) G cc が窒素の場合、E cc は炭素又は窒素であり；(c) E cc と G cc の両者が窒素の場合、G cc が炭素であり、E cc が酸素、硫黄、スルホキシド又はスルホンの場合、R^{2cc}はなく；(d) 環D cc の1-、2-及び3-位の原子の各々は1つをこえた二重結合で結合することはなく；(e) R^{11cc}が酸素の場合、環D cc に二重結合し、R^{11cc}が酸素以外の場合、環D cc に一重結合し；(f) X cc と R^{11cc}の両者が酸素で、かつ各々環D cc の1-及び3-位の炭素に結合している、又は各々環D cc の3-及び1-位の炭素に結合している場合、環D cc の2-位の炭素は窒素で置換されており；(g)



10

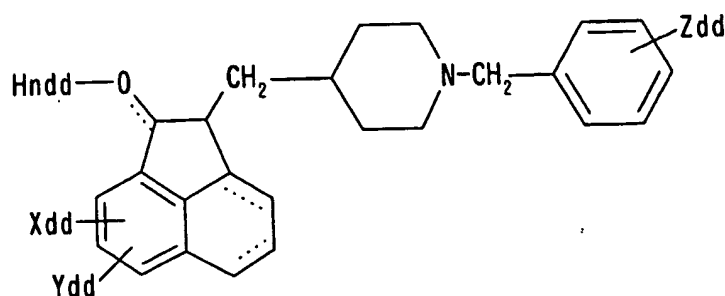
- を含有する炭化水素基が結合している位置に隣接する位置でX cc が環D cc に結合する。) で表される化合物又はその塩。具体例としては、2, 3-ジヒドロ-2-[[1-(フェニルメチル)-4-ピペリジニル]メチレン]-1H-ピロロ[1, 2-a]インドール-1-オン、1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-4-メチル-2-[[1-(フェニルメチル)-4-ピペリジニル]メチレン]-シクロペント[b]インドール-3-オン、2, 3-ジヒドロ-2-[[1-(フェニルメチル)-4-ピペリジニル]メチル]-1H-ピロロ[1, 2-a]ベンズイミダゾール-1-オン、1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-6-メチル-2-[[1-(フェニルメチル)-4-ピペリジニル]エチル]-ピロロ[3, 4-b]インドール-3-オン等が挙げられる。

20

上記化合物又はその塩は、特開平4-234845号公報(E P-A-441517)記載の方法又はそれに準じた方法により製造される。

5) 式

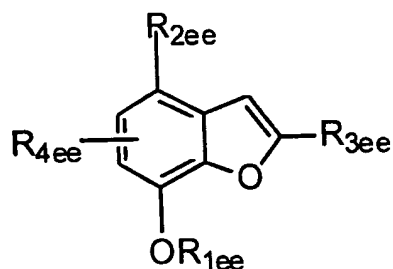
59



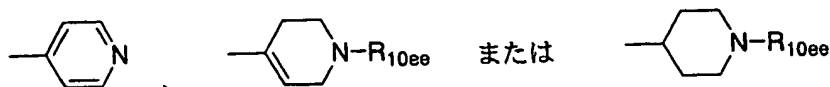
- 〔式中、X dd は水素、低級アルキル、低級アルコキシ、ヒドロキシ又はニトロ
 ; Y dd は水素又は低級アルコキシ;又はX dd とY dd はいっしょに結合して基
 -OCH₂O-を形成(この場合にはベンゼン環部分のXdd とYdd の各位置は
 互いに隣接していなければならない); Z dd は水素、低級アルキル、低級アル
 コキシ、ヒドロキシ、ハロゲン又はニトロ; n dd は0又は1である。〕で表さ
 れる化合物又はその塩。具体例としては2-[(N-ベンジルピペリジン-4-
 10 イル)メチル]-2a, 3, 4, 5-テトラヒドロ-1(2H)-アセナフ
 チレン-1-オン、2-[[N-(3-フルオロベンジル)ピペリジン-4-
 イル]メチル]-2a, 3, 4, 5-テトラヒドロ-1(2H)-アセナフチ
 レン-1-オン等が挙げられる。

上記化合物又はその塩は、特開平6-116237号公報(EP-A-51
 7221, USP 5, 106, 856)記載の方法又はそれに準じた方法によ
 り製造される。

15 6) 式



〔式中、R_{1ee}は水素、低級アルキル、アリール低級アルキル、CONHR₁₁
{ee}又はCONR{6ee}R_{7ee}; R_{2ee}は水素、シアノ、CH₂NR_{8ee}R_{9ee}、CO
 NHR_{5ee}又はCONR_{6ee}R_{7ee}; R_{3ee}は

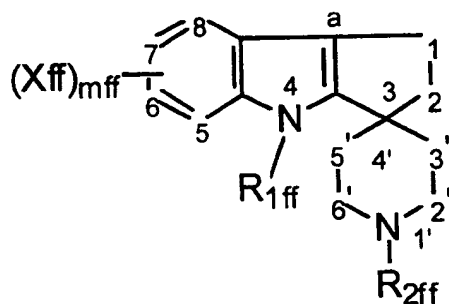


- 20 (ここで、R_{10ee}は水素、低級アルキル、アリール低級アルキル、CONHR

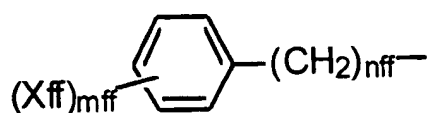
- 5 $_{5ee}$ 、 $CONR_{6ee}R_{7ee}$ 、アシル、アシルオキシ低級アルキル又はアシルオキシアリール低級アルキルである) ; R_{4ee} は水素、ハロゲン、低級アルキル又は低級アルコキシ ; R_{5ee} は水素、低級アルキル又はアリール低級アルキル ; R_{6ee} は低級アルキル又はアリール低級アルキル ; R_{7ee} は低級アルキル又はアリール低級アルキル ; R_{8ee} は水素、低級アルキル、アリール低級アルキル又はアシル ; R_{9ee} は水素、低級アルキル又はアリール低級アルキル ; R_{11ee} は低級アルキル、アリール又はアリール低級アルキルである。但し、 R_{1ee} が水素又は低級アルキルである場合、 R_{2ee} は水素ではない。) で表される化合物又はその塩。具体例としては、1-メチル-4-(4-シアノ-7-メトキシ-2-ベンゾフラニル) ピペリジン、1-メチル-4-(4-N, N-ジエチルアミド-7-メトキシ-2-ベンゾフラニル) ピペリジン、1-メチル-4-(4-N, N-ジエチルアミノメチル-7-メトキシ-2-ベンゾフラニル) ピペリジン等が挙げられる。

- 15 上記化合物又はその塩は、特開平7-109275号公報記載の方法又はそれに準じた方法により製造される。

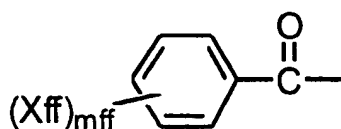
7) 式



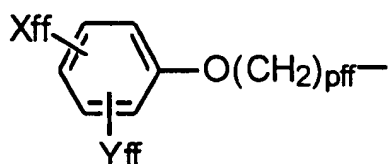
- 〔式中、 X_{ff} は水素、ハロゲン、低級アルコキシ、低級アルキル、ヒドロキシ又はトリフルオロメチル ; m_{ff} は1又は2 ; R_{1ff} は水素又は低級アルキル ; R_{2ff} は水素、式



- (式中、 n_{ff} は1又は2、 X_{ff} 及び m_{ff} は上記と同意義を示す) で表される基、式



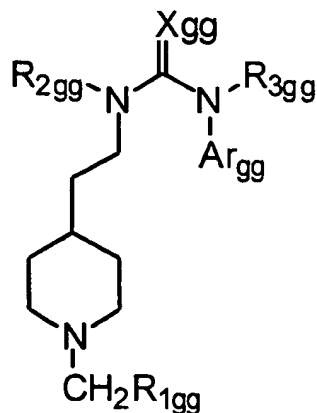
(式中、X ff とm ff は上記と同意義を示す) で表される基、又は式



- 5 (式中、X ff は上記と同意義、Y ff は水素又は式： COR_{4ff} (式中、 R_{4ff} は水素又は低級アルキルを示す)、p ff は2又は3を示す) である。) で表される化合物又はその塩。具体的には、1, 4-ジヒドロ-7-メトキシ-4-メチル-1'-フェニルメチルスピロ[シクロペント[b]インドール-3 (2H), 4'-ピペリジン]、1, 4-ジヒドロ-4-メチル-1'-(4-メトキシフェニル)メチルスピロ[シクロペント[b]インドール-3 (2H), 4'-ピペリジン] 等が挙げられる。
- 10

上記化合物又はその塩は、WO 97/37992記載の方法又はそれに準じた方法により製造される。

8) 式

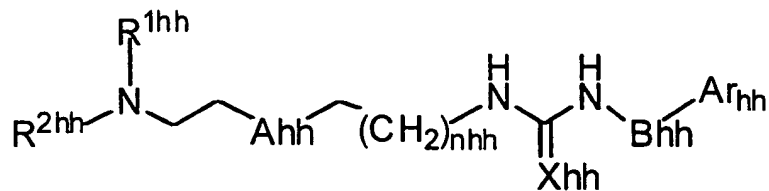


15

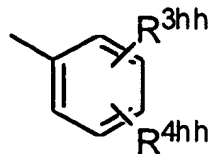
- (式中、 R_{1gg} は C_{5-7} シクロアルキル基、フェニル基、又は C_{1-4} アルキル基、 C_{1-4} アルコキシ基、ニトロ基若しくはハロゲン原子で置換されたフェニル基； R_{2gg} 及び R_{3gg} は、互いに独立して水素原子又は C_{1-4} アルキル基；X gg はイオウ原子、酸素原子、 CH-NO_2 基又は N-R_{5gg} 基 (ここで R_{5gg} は水素原子、ヒドロキシル基、 C_{1-4} アルコキシ基、 C_{1-4} アルキル基、シアノ基又
- 20

- は C_{1-4} アルキルスルホニル基； A_{rgg} は、ハロゲン原子、 C_{1-4} アルキル基、 C_{1-4} アルコキシ基、 C_{1-4} アシル基、シアノ基、ニトロ基、トリフルオロメチル基及びトリフルオロメトキシ基から選ばれる置換基を1若しくは2以上それぞれ有していてもよいピリジル基又はフェニル基を意味する。〕で表される化合物又はその塩。具体例としては、N'-フェニル-N'-[2-(1-ベンジル-4-ピペリジル)エチル]-1, 1-ジアミノ-2-ニトロエチレン、1-(2-ピリジル)-3-[2-(1-ベンジル-4-ピペリジル)エチル]チオ尿素、1-フェニル-2-ヒドロキシ-3-[2-(1-ベンジル-4-ピペリジル)エチル]グアニジン等が挙げられる。
- 10 上記化合物又はその塩は、特開平5-148228号公報（EP-A-516520）に記載の方法又はそれに準じた方法により製造される。

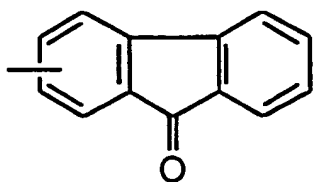
9) 式



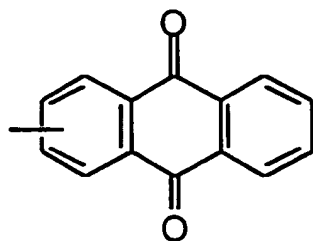
- 〔式中、 R^{1hh} は C_{1-4} アルキル基、 R^{2hh} は C_{5-7} シクロアルキル基、 C_{5-7} シクロアルキル-メチル基、ベンジル基、又は C_{1-4} アルキル基、 C_{1-4} アルコキシ基、ハロゲン原子若しくはニトロ基を有するベンジル基； A_{hh} は酸素原子又はメチレン基； B_{hh} は直接結合、メチレン基又はカルボニル基； A_{rhh} はピリジル基、下式のフェニル基、
- 15



- 20 （ここで、 R^{3hh} と R^{4hh} は互いに独立して、水素、ハロゲン原子、ニトロ基、 C_{1-4} アルキル基、 C_{1-4} アルコキシ基、フェニル基又はトリフルオロメトキシ基を意味する）、下式のオキソフルオレニル基、

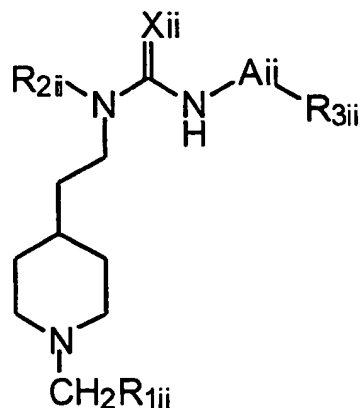


下式のジオキサアントラセニル基、

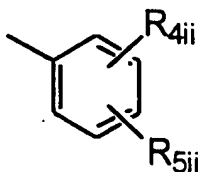


- 又はナフチル基を、n hh は1又は2を、X hh は酸素原子又はイオウ原子を意味する。) で表される化合物又はその塩。具体例としては、1-[2-[2-(N-ベンジル-N-メチルアミノ)エトキシ]エチル]-3-(3-ニトロベンゾイル)チオ尿素、1-[2-[2-(N-ベンジル-N-メチルアミノ)エトキシ]エチル]-3-(9-オキソ-2-フルオレノイル)チオ尿素等が挙げられる。
- 10 上記化合物又はその塩は、特開平5-194359号公報(E P-A-526313)に記載の方法又はそれに準じた方法により製造される。

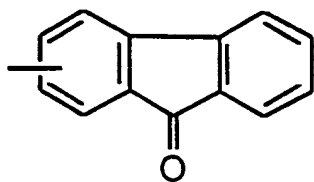
10) 式



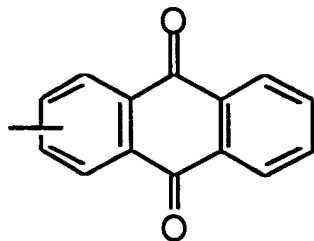
- 〔式中、 R_{1ii} は C_{5-7} シクロアルキル基、フェニル基、又は C_{1-4} アルキル基、 C_{1-4} アルコキシル基若しくはハロゲン原子で置換されたフェニル基； R_{2i} は水素原子又は C_{1-4} アルキル基； X_{ii} は酸素原子又はイオウ原子； A_{ii} はメチレン基、カルボニル基又はスルホニル基； R_{3ii} は①式
- 15



- (ここで、 R_{4ii} と R_{5ii} は互いに独立して、水素、ハロゲン原子、ニトロ基、 C_{1-4} アルキル基、 C_{1-4} アルコキシ基、 C_{1-4} アシル基、ベンゾイル基、 C_{1-4} アルキルスルホニル基又はトリフルオロメトキシ基を表すか、又は R_{4ii} と R_{5ii} が一緒になってメチレンジオキシ基を形成)で表される基、②式



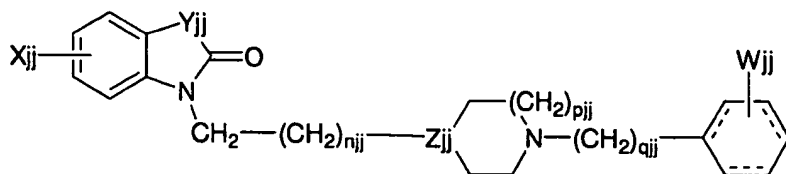
で表される基又は③式



- で表される基；但し、 X_{ii} が酸素原子を表すときは、 A_{ii} はメチレン基以外の基を表す。)で表される化合物又はその塩。具体例としては、1-(3-ニトロベンゾイル)-3-[2-(1-ベンジル-4-ピペリジル)エチル]チオ尿素、1-(9,10-ジオキソ-2-アントラセノイル)-3-[2-(1-ベンジル-4-ピペリジル)エチル]チオ尿素等が挙げられる。

- 上記化合物又はその塩は、特表平6-507387号公報(WO 92/14710)に記載の方法又はそれに準じた方法により製造される。

11) 式

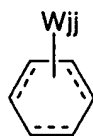


〔式中、 n_{jj} は1、2又は3であり； p_{jj} は1又は2であり； q_{jj} は1又は2であり； X_{jj} は独立して水素、低級アルキル、アリール、アリールオキシ、

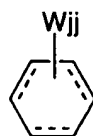
- CN、低級アルコキシ、ハロゲン、ヒドロキシ、ニトロ、トリフルオロメチル、アルキルスルホンアミド、 NHCOR_{jj} （ここで、 R_{jj} は低級アルキル又はアリールである）、 $\text{NR}_{1jj}\text{R}_{2jj}$ （ここで、 R_{1jj} 及び R_{2jj} は独立して水素又は低級アルキルであるか、一緒になって環を形成する）、 CO_2R_{jj} （ここで、 R_{jj} は低級アルキルである）、又は場合によっては、更に低級アルキルにより置換されたシクロアルキル、シクロアルケニル若しくはビシクロアルキルから選択される1個以上の置換基であり； Y_{jj} はCO又は $\text{CR}_{3jj}\text{R}_{4jj}$ （ここで、 R_{3jj} 及び R_{4jj} は独立して水素、低級アルキル、低級アルコキシであるか、又は一緒になって環状アセタールを形成する）であり； Z_{jj} はN又はC
- 10 Hであり；



は場合によっては置換されたフェニル又はシクロヘキシル基である（ここで、 W_{jj} は独立して水素、低級アルキル、低級アルコキシ又はハロゲンから選択される1個以上の置換基である）〕で表される化合物（但し、 $n_{jj}=1$ 、 $p_{jj}=1$ 、 $q_{jj}=1$ 、 $\text{X}_{jj}=\text{H}$ 、 $\text{Y}_{jj}=\text{CO}$ 、 $\text{Z}_{jj}=\text{N}$ かつ



- 15 が未置換フェニルである化合物、及び $n_{jj}=2$ 、 $p_{jj}=1$ 、 $q_{jj}=1$ 、 $\text{X}_{jj}=\text{H}$ 、 $\text{Y}_{jj}=\text{CO}$ 、 $\text{Z}_{jj}=\text{N}$ かつ

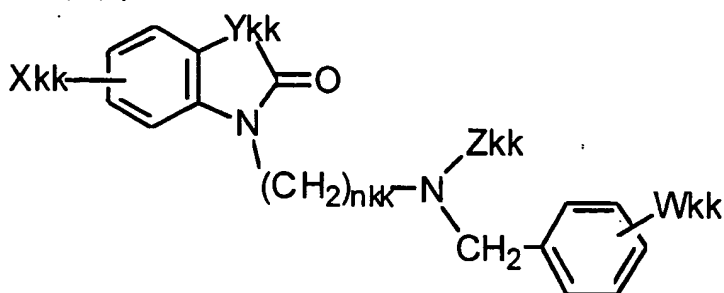


- が4-クロロフェニルである化合物を除く）、その立体異性体、光学異性体、ラセミ体又はそれらの塩。具体例としては、5-シロヘキシル-1，3-ジヒドロ-1-[2-[1-(フェニルメチル)-4-ピペリジニル]エチル]-2H-インドール-2-オン等が挙げられる。
- 20

上記化合物又はその塩は、特表平7-502272号公報(WO 93/12

085)に記載の方法又はそれに準じた方法により製造される。

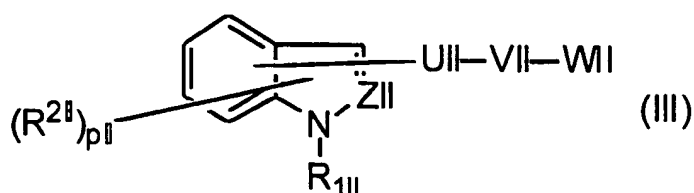
12)式



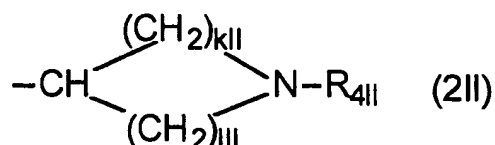
〔式中、 n_{kk} は3、4、5、6又は7； X_{kk} は独立して水素、低級アルキル、
 5 アリール、低級アルコキシ、ハロゲン、トリフルオロメチル、ニトロ、 $-NH$
 $CO R_{kk}$ （ここで、 R_{kk} は低級アルキル又はアリールである）、 $-NR_{1kk}R_{2kk}$
 k （ここで、 R_{1kk} 及び R_{2kk} は独立して水素又は低級アルキルであるか、又は
 一緒になって環を形成する）、又は場合によっては、更に低級アルキルにより
 置換されたシクロアルキル、シクロアルケニル若しくはビスシクロアルキルから
 10 選択される1個以上の置換基； Y_{kk} は CO 又は $CR_{3kk}R_{4kk}$ （ここで、 R_{3kk}
 及び R_{4kk} は独立して水素、低級アルキル、低級アルコキシであるか、又は一
 緒になって環状アセタールを形成する）； Z_{kk} は低級アルキル；そして、 W_{kk}
 は独立して水素、低級アルキル、低級アルコキシ又はハロゲンから選択される
 1個以上の置換基である。〕で表される化合物、その立体異性体、光学異性体
 15 、ラセミ体又はそれらの塩。具体例として、5-シクロヘキシル-1,3-ジ
 ヒドロ-1-[5-(N-エチル-N-フェニルメチルアミノ)ペンチル]-
 2H-インドール-2-オン、5-シクロヘキシル-1-[5-(N-エチル
 -N-フェニルメチルアミノ)ペンチル]-1H-インドール-2,3-ジオ
 ン等が挙げられる。

20 上記化合物又はその塩は、特表平8-511515号公報(WO 94/29
 272)に記載の方法又はそれに準じた方法により製造される。

13)式



- 〔式中、 R_{111} 及び R_{211} は、それぞれ水素原子、下記置換基群A 11より選択された基、又は下記置換基群A 11より選択された1ないし3個の置換基（同一又は異なって）をそれぞれ有していてもよいアリール基、アラルキル基、アラルキルオキシカルボニル基、アリールアミノ基、アリールアミノアルキル基、
- 5 複素環基、複素環アルキル基若しくは複素環アミノアルキル基； p_{11} は1ないし3の整数を示す。； U_{11} は式： $-CO-$ 又は $-CH(OR_{311})-$ で表される基（式中、 R_{311} は水素原子又は水酸基の保護基を示す）； V_{11} は式： $-(CH=CH)m_{11}-(CH_2)n_{11}-$ で表される基（式中、 m_{11} は0ないし2、 n_{11} は0ないし7の整数を示す。但し、 m_{11} 及び n_{11} が同時に0であることはない）； W_{11} は環内窒素原子上に V_{11} と結合点を有する含窒素複素環基、式
- 10



- で表される基（式中、 k_{11} 及び l_{11} は同一又は異なって1ないし4、 R_{411} は後記の R_{511} 及び R_{611} と同意義を有する）；前記一般式(211)において、環アルキレン基が5又は6員環を形成するとき、該5又は6員環中のエチレン基と
- 15 1又は2個のベンゼン環が縮合してなる基、又は式： $-NR_{511}R_{611}$ で表される基（式中、 R_{511} 及び R_{611} はそれぞれ、水素原子、下記置換基群A 11より選択される基、又は下記置換基群A 11より選択された1ないし3個の置換基（同一又は異なって）をそれぞれ有していてもよいアリール基、アリールカルボニル基、アラルキル基、複素環基若しくは複素環アルキル基を示す。）を示す。
- 20

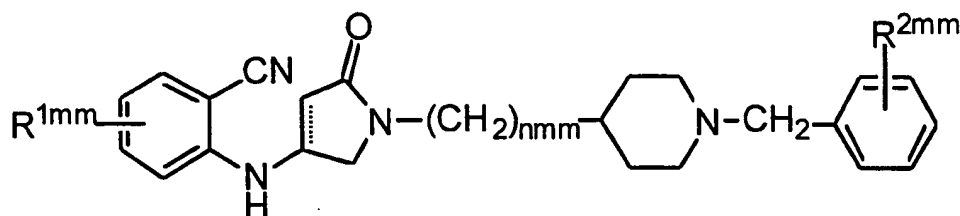
置換基群A 11：

- 低級アルキル基、シクロアルキル基、アリール基、複素環基、アラルキル基、ハロゲン原子、アミノ基、低級アルキルアミノ基、アリールアミノ基、アミノ
- 25 低級アルキル基、低級アルキルアミノアルキル基、低級アルキニルアミノアルキル基、ニトロ基、シアノ基、スルフォニル基、低級アルキルスルフォニル基、ハロゲノアルキルスルフォニル基、低級アルカノイル基、アリールカルボニル基、アリールアルカノイル基、低級アルコキシ基、低級アルコキシカルボニ

- ル基、ハロゲン低級アルキル基、N-低級アルキニル、N-シアノアミノ基、N-低級アルキニル及びN-メチルアミノメチル基。)で表される化合物又はその塩。具体例としては、1-メチル-3-[3-(1-ベンジル-4-ピペリジル)プロピオニル]インドール、1-メチル-3-[3-[1-(3-フルオロベンジル)-4-ピペリジル]プロピオニル]-5-フルオロインドール、1-メチル-3-[3-[1-(2-クロロベンジル)-4-ピペリジル]プロピオニル]インダゾール等が挙げられる。

上記化合物又はその塩は、特開平6-41070号公報(E P-A-562832)に記載の方法又はそれに準じた方法により製造される。

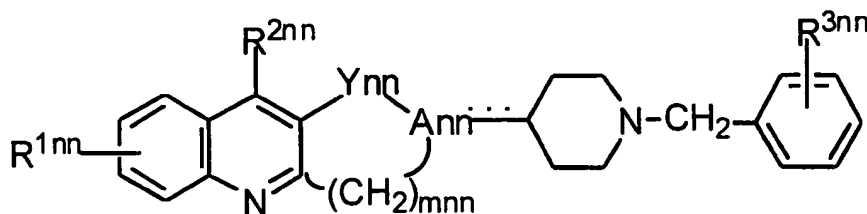
- 10 14) 式



- [式中、R^{1mm}は水素原子、ハロゲン原子、アルキル基、アルコキシ基又はアルキルチオ基；R^{2mm}は水素原子、ハロゲン原子、アルキル基又はアルコキシ基；nmmは0～7の整数；破線は二重結合が存在してもよいことを示す。]で表される化合物又はその塩。具体例としては、N-[1-[4-(1-ベンジルピペリジル)エチル]-2-オキソ-3-ピロリン-4-イル]-2-アミノベンゾニトリル、N-[1-[4-(1-ベンジルピペリジル)プロピル]-2-オキソ-3-ピロリン-4-イル]-2-アミノベンゾニトリル等が挙げられる。

- 20 上記化合物又はその塩は、特開平5-9188号公報に記載の方法又はそれに準じた方法により製造される。

- 15) 式

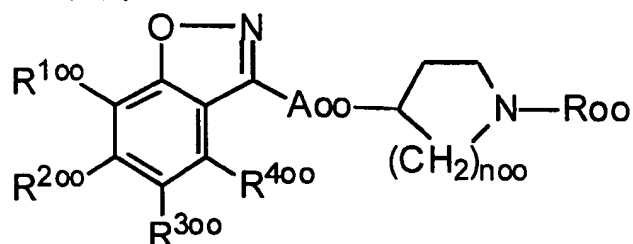


[式中、



- は、 $>\text{N}-(\text{CH}_2)_{nnn}-$ 、 $>\text{C}=\text{}$ 、 $>\text{C}=\text{CH}(\text{CH}_2)_{nnn}-$ 又は $>\text{C}$
 $\text{H}(\text{CH}_2)_{nnn}-$ (ここで nnn は 0~7 の整数を示す) ; Ynn は $>\text{C}=\text{O}$ 又
 5 又は $>\text{CHOH}$; R^{1nn} は水素原子、ハロゲン原子、アルキル基、アルコキシ基
 、アルキルチオ基 ; R^{2nn} は水素原子、ハロゲン原子、水酸基、アルキル基
 、アルコキシ基、置換基を有してもよいフェニル基、フェノキシ基、アルカノ
 イルオキシ基又は置換基を有してもよいアミノ基 ; R^{3nn} は水素原子、ハロゲ
 ン原子、アルキル基又はアルコキシ基 ; mnn は 1~3 の整数を示す。) で表さ
 10 れる化合物又はその塩。具体例としては、9-アミノ-2-[4-(1-ベン
 ジルピペリジル) エチル]-2, 3-ジヒドロピロロ[3, 4-b]キノリン-
 1-オン、9-アミノ-2-[2-(1-ベンジルピペリジン-4-イル) エ
 チル]-1, 2, 3, 4-テトラヒドロアクリジン-1-オン、9-メトキシ
 -2-[4-(1-ベンジルピペリジル) エチル]-2, 3-ジヒドロピロロ
 [3, 4-b]キノリン-1-オン等が挙げられる。
 15 上記化合物又はその塩は、特開平 5-279355 号公報 (EP-A-48
 1429) に記載の方法又はそれに準じた方法により製造される。

16) 式

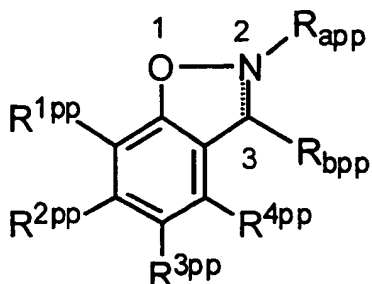


- 〔式中、 R_{00} は水素、アルキル、アルケニル、シクロアルキルアルキル、フェ
 20 ニルアルキル、ナフチルアルキル、シクロアルキルアルケニル、フェニルアル
 ケニル又はナフチルアルケニル ; R^{100} 、 R^{200} 、 R^{300} 及び R^{400} は同一又は
 異なって、それぞれ水素、ハロゲン、アルキル、フェニル、フェニルアルキル
 、アルコキシ、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、フェニルアルコキ
 シ、フェノキシ、ヘテロアリールアルコキシ、ヘテロアリールオキシ、アシル
 25 、アシルオキシ、水酸基、ニトロ、シアノ、 $-\text{NHCOR}^{500}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_{m00}$
 R^{500} 、 $-\text{NH}\text{SO}_2\text{R}^{500}$ 、 $-\text{CONR}^{600}\text{R}^{700}$ 、 $-\text{NR}^{600}\text{R}^{700}$ 、 $-\text{OC}$

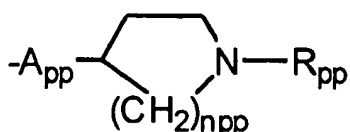
$\text{ONR}^{600}\text{R}^{700}$ 、 $-\text{OCSNR}^{600}\text{R}^{700}$ 、 $-\text{SO}_2\text{NR}^{600}\text{R}^{700}$ 又は $-\text{COOR}^{800}$; 又は R^{100} 、 R^{200} 、 R^{300} 及び R^{400} の隣接するものが相互に結合して、置換基を有してもよい $-\text{O}(\text{CH}_2)_{p00}-$ 、 $-\text{O}(\text{CH}_2)_{q00}\text{O}-$ 、 $-\text{O}(\text{CH}_2)_{r00}\text{N}(\text{R}^{900})-$ 、 $-\text{O}(\text{CH}_2)_{s00}\text{CON}(\text{R}^{900})-$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{900})\text{CO}-\text{CH}=\text{CH}-$ 又はベンゼン環若しくは複素芳香環を形成する基を示す(ここで、 R^{500} は、アルキル、フェニル又はフェニルアルキル; R^{600} 及び R^{700} は同一又は異なって、それぞれ水素、アルキル、フェニル又はフェニルアルキルを示すか、隣接する窒素原子を結合して複素環を形成する基; R^{800} は、アルキル、フェニル又はフェニルアルキル; R^{900} は、水素、アルキル、フェニルアルキル又はアシル; m_{00} は、0、1 又は 2; p_{00} 、 q_{00} 、 r_{00} 及び s_{00} は同一又は異なって、1、2、又は 3 を示す); A_{00} は直鎖又は分枝鎖状のアルキレン; n_{00} は 1、2、又は 3; 上記定義中、アルキル、アルケニル、アルコキシ、フェニル、フェノキシ、シクロアルキルアルキル、フェニルアルキル、ナフチルアルキル、シクロアルキルアルケニル、フェニルアルケニル、ナフチルアルケニル、フェニルアルコキシ、ヘテロアリール、ヘテロアリールオキシ、ヘテロアリールアルキル、ヘテロアリールアルコキシ、ベンゼン環及び複素芳香環は、ハロゲン、アルキル、アルコキシ、アシル、アシルオキシ、水酸基、ニトロ、シアノ、 $-\text{NHCOR}^{500}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_{m_{00}}\text{R}^{500}$ 、 $-\text{NH}\text{SO}_2\text{R}^{500}$ 、 $-\text{CONR}^{600}\text{R}^{700}$ 、 $-\text{NR}^{600}\text{R}^{700}$ 、 $-\text{OCONR}^{600}\text{R}^{700}$ 、 $-\text{OCSNR}^{600}\text{R}^{700}$ 、 $-\text{SO}_2\text{NR}^{600}\text{R}^{700}$ 又は $-\text{COOR}^{800}$ (ここで、 R^{500} 、 R^{600} 、 R^{700} 、 R^{800} 及び m_{00} は前記と同義である) から選ばれる 1 ないし 3 個の置換基を有していてもよい。) で表される化合物又はその塩。具体例としては、3-[2-(1-ベンジル-4-ピペリジル)エチル]-6,7-ジメトキシ-1,2-ベンゾイソオキサゾール、3-[2-(1-ベンジル-4-ピペリジル)エチル]-6-(N-メチルアセトアミノ)-1,2-ベンゾイソオキサゾール等が挙げられる。

上記化合物又はその塩は、特開平 5-320160 号公報 (WO 93/04063) に記載の方法又はそれに準じた方法により製造される。

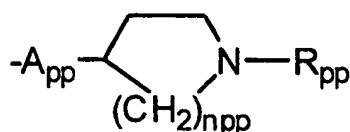
17) 式



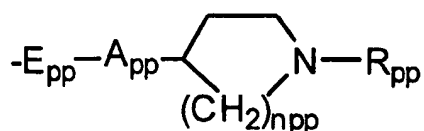
〔式中、2位と3位の間の結合が単結合を示すとき、 R_{app} は式



- (式中、 R_{pp} は水素、アルキル、アルケニル、シクロアルキルアルキル、シクロアルキルアルケニル、フェニルアルキル、フェニルアルケニル、ナフチルアルキル又はナフチルアルケニル； A_{pp} は直鎖又は分枝鎖状のアルキレン； n_{pp} は1、2、又は3を示す)により表される基を示し、 R_{bpp} は酸素を示す。2位と3位の間の結合が二重結合を示すとき、 R_{app} は存在せず、 R_{bpp} は式



- 10 (式中の各記号は前記と同意義である)により表される基又は式



- (式中、 E_{pp} は酸素、硫黄を示し、他の各記号は前記と同意義である)により表される基； R^{1pp} 、 R^{2pp} 、 R^{3pp} 及び R^{4pp} は同一又は異なって、それぞれ水素、ハロゲン、アルキル、アルコキシ、フェニル、フェニルアルキル、フェニルアルコキシ、フェノキシ、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、ヘテロアリールアルコキシ、ヘテロアリールオキシ、アシル、アシルオキシ、水酸基、ニトロ、シアノ、 $-NHCOR^{5pp}$ 、 $-S(O)_{m_{pp}}R^{5pp}$ 、 $-NH SO_2 R^{5pp}$ 、 $-CONR^{6pp}R^{7pp}$ 、 $-NR^{6pp}R^{7pp}$ 、 $-OCSNR^{6pp}R^{7pp}$ 、 $-SO_2NR^{6pp}R^{7pp}$ 又は $-COOR^{8pp}$ を示す。(R^{5pp} は、アルキル、フェニル又はフェニルアルキル； R^{6pp} 及び R^{7pp} は同一又は異なって、それぞれ水

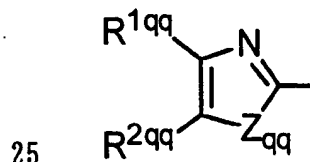
素、アルキル、フェニル又はフェニルアルキルを示すか、隣接する窒素原子と結合して複素環を形成する基； R^{8pp} は、水素、アルキル、フェニル又はフェニルアルキル； mpp は、0、1又は2を示す；上記定義中、アルキル、アルケニル、アルコキシ、フェニル、フェニルアルキル、フェニルアルケニル、フェニルアルコキシ、フェノキシ、シクロアルキルアルキル、シクロアルキルアルケニル、ナフチルアルキル、ナフチルアルケニル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、ヘテロアリールアルコキシ及びヘテロアリールオキシは、ハロゲン、アルキル、アルコキシ、アシル、アシルオキシ、水酸基、ニトロ、シアノ、 $-NHCOR^{5pp}$ 、 $-S(O)_{mpp}R^{5pp}$ 、 $-NH SO_2 R^{5pp}$ 、 $-CONR^{6pp}R^{7pp}$ 、 $-NR^{6pp}R^{7pp}$ 、 $-OCONR^{6pp}R^{7pp}$ 、 $-OCSNR^{6pp}R^{7pp}$ 、 $-SO_2NR^{6pp}R^{7pp}$ 又は $-COOR^{8pp}$ (R^{5pp} 、 R^{6pp} 、 R^{7pp} 、 R^{8pp} 及び mpp は前記と同意義である) から選ばれる1ないし3個の置換基を有していてもよい。) で表される化合物又はその塩。具体例としては、3-[2-(1-ベンジル-4-ピペリジル)エチル]-6,7-ジメトキシ-1,2-ベンゾイソオキサゾール、6-ベンゾイルアミノ-2-[3-(1-ベンジル-4-ピペリジル)プロピル]-1,2-ベンゾイソオキサゾール-3(2H)-オン、6-ベンゾイルアミノ-2-[2-(1-ベンジル-4-ピペリジル)エチル]-1,2-ベンゾイソオキサゾール-3(2H)-オン等が挙げられる。

上記化合物又はその塩は、特開平6-41125号公報(WO 93/04063)に記載の方法又はそれに準じた方法により製造される。

18) 式

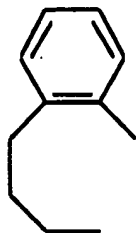
$M^{qq}-W^{qq}-Y^{qq}-A^{qq}-Q^{qq}$

〔式中、 M^{qq} は式：

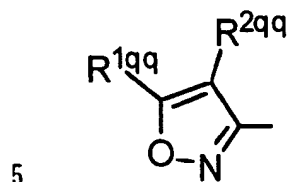


〔式中、 R^{1qq} は水素、低級アルキル、置換基を有していてもよい複素環基又は置換基を有していてもよいアリール； R^{2qq} は、水素、低級アルキル、置換基を有していてもよい複素環基又は置換基を有していてもよいアリールを表わ

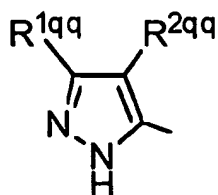
すか、又は、 R^{1qq} と R^{2qq} が互いに結合して、式：



で表される基を形成； Z_{qq} は、S又はOをそれぞれ示す）で表される基、式：

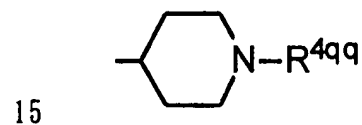


（式中、 R^{1qq} 及び R^{2qq} は前記と同意義を示す）で表される基、又は式：



（式中、 R^{1qq} 及び R^{2qq} は前記と同意義を示す）で表される基； W_{qq} は、結合、低級アルキレン又は低級アルケニレン； Y_{qq} は、低級アルキレン、 $-NH-$ 、 $-CO-$ 、 $-CONR^{3qq}-$ （式中、 R^{3qq} は水素又は低級アルキルを示す）の基又は式： $-CHR^{7qq}-$ （式中、 R^{7qq} はヒドロキシ又は保護されたヒドロキシを示す）の基； A_{qq} は、結合又は低級アルキレン； Q_{qq} は、式： $-NR^{8qq}R^{9qq}$ （式中、 R^{8qq} は低級アルキル； R^{9qq} はアル（低級）アルキルを示す）の基又は式：

10

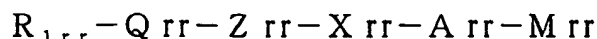


（式中、 R^{4qq} は低級アルキル又は置換基を有していてもよいアル（低級）アルキルを示す）で表される基をそれぞれ示す。）で表される化合物又はその塩。具体例としては、4-（ピリジン-3-イル）-5-メチル-2-[[2-（1-ベンジルピペリジン-4-イル）エチル]カルバモイル]チアゾール、

2- [[2-(1-ベンジルピペリジン-4-イル) エチル] カルバモイル]
 -4-(4-クロロフェニル)-5-メチルオキサゾール、5- [[2-(1-
 ベンジルピペリジン-4-イル) エチル] カルバモイル] -3-(4-ニト
 ロフェニル) ピラゾール等が挙げられる。

- 5 上記化合物又はその塩は、特開平5-345772号公報に記載の方法又は
 それに準じた方法により製造される。

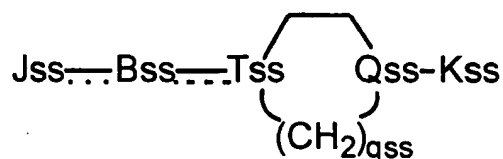
19) 式



- 〔式中、 R_{1rr} は低級アルキル、置換基を有していてもよい複素環基、置換基
 10 を有していてもよいアリール、置換基を有していてもよいアル（低級）アルキ
 ル又はアル（低級）アルケニル； Q_{rr} はオキサジアゾールジイル； Z_{rr} は結
 合又はビニル； X_{rr} は結合、式： $-\text{CONR}_{4rr}-$ （式中、 R_{4rr} は水素又は
 低級アルキルを示す）、式： $-\text{CHR}_{8rr}-$ （式中、 R_{8rr} はヒドロキシ又は保
 護されたヒドロキシを示す）、 $-\text{CO}-$ 又は $-\text{NHCO}-$ ； A_{rr} は結合、
 15 低級アルキレン又は低級アルケニレン； M_{rr} は、低級アルキル、イミノ保護基
 及び置換基を有していてもよいアル（低級）アルキルからなる群から選ばれる
 1個の置換基を有していてもよい少なくとも1個の窒素原子を含む複素環基を
 それぞれ示す。〕で表される化合物又はその塩。具体例としては、5-(キヌ
 クリジン-3-イル)-3- [[2-(1-ベンジルピペリジン-4-イル)
 20 エチル] カルバモイル] -1, 2, 4-オキサジアゾール、3- [[2-(1-
 ベンジルピペリジン-4-イル) エチル] カルバモイル] -5-(4-ニト
 ロフェニル)-1, 2, 4-オキサジアゾール等が挙げられる。

上記化合物又はその塩は、特表平7-502529号公報(WO 93/13
 083)に記載の方法又はそれに準じた方法により製造される。

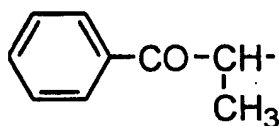
- 25 20) 式



〔式中、 J_{ss} は(a)置換若しくは無置換の次に示す基；(1)フェニル基、
 (2)ピリジル基、(3)ピラジル基、(4)キノリル基、(5)シクロヘキ

シル基、(6) キノキサリル基又は(7) フリル基、

(b) フェニル基が置換されていてもよい次の群から選択された一価又は二価の基；(1) インダニル、(2) インダノニル、(3) インデニル、(4) インデノニル、(5) インダンジオニル、(6) テトラロニル、(7) ベンズスベロニル、(8) インダノリル、(9) 式



で示される基、

(c) 環状アミド化合物から誘導される一価の基、

(d) 低級アルキル基、又は

10 (e) 式 $R_{1ss} - CH=CH -$ (式中、 R_{1ss} は水素原子又は低級アルコキシカルボニル基を意味する) で示される基を意味する。

B_{ss} は式 $-(CHR_{2ss})_{nss} -$ で示される基、式 $-CO-(CHR_{2ss})_{nss} -$ で示される基、式 $-NR_{3ss}-(CHR_{2ss})_{nss} -$ (式中、 R_{3ss} は水素原子、低級アルキル基、アシル基、低級アルキルスルホニル基、置換されていて

15 もよいフェニル基又はベンジル基を意味する) で示される基、式 $-CO-NR_{4ss}-(CHR_{2ss})_{nss} -$ (式中、 R_{4ss} は水素原子、低級アルキル基又はフェニル基を意味する) で示される基、式 $-CH=CH-(CHR_{2ss})_{nss} -$ で示される基、式 $-O-COO-(CHR_{2ss})_{nss} -$ で示される基、式 $-O-CO-NH-(CHR_{2ss})_{nss} -$ で示される基、式 $-NH-CO-(CHR_{2ss}$

20 $)_{nss} -$ で示される基、式 $-CH_2-CO-NH-(CHR_{2ss})_{nss} -$ で示される基、式 $-(CH_2)_2-CO-NH-(CHR_{2ss})_{nss} -$ で示される基、式 $-C(OH)H-(CHR_{2ss})_{nss} -$ で示される基 (以上の式中、 n_{ss} は 0 又は 1 ~ 10 の整数を意味する。 R_{2ss} は式 $-(CHR_{2ss})_{nss} -$ で示されるアルキレン基が置換基を持たないか、又は 1 つ又は 1 つ以上のメチル基を有している

25 ような形で水素原子又はメチル基を意味する)、式 $=(CH-CH=CH)_{bss} -$ (式中、 b_{ss} は 1 ~ 3 の整数を意味する) で示される基、式 $=CH-(CH_2)_{css} -$ (式中、 c_{ss} は 0 又は 1 ~ 9 の整数を意味する) で示される基、式 $=(CH-CH)_{dss} =$ (式中、 d_{ss} は 0 又は 1 ~ 5 の整数を意味する) で示さ

れる基、式 $-\text{CO}-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}_2-$ で示される基、式 $-\text{CO}-\text{CH}_2-$
 $-\text{C}(\text{OH})\text{H}-\text{CH}_2-$ で示される基、式 $-\text{C}(\text{CH}_3)\text{H}-\text{CO}-\text{NH}-\text{CH}_2-$
 で示される基、式 $-\text{CH}=\text{CH}-\text{CO}-\text{NH}-(\text{CH}_2)_2-$ で示される基、
 式 $-\text{NH}-$ で示される基、式 $-\text{O}-$ で示される基、式 $-\text{S}-$ で示され
 5 る基、ジアルキルアミノアルキルカルボニル基又は低級アルコキシカルボニル
 基を意味する。

T ss は窒素原子又は炭素原子を意味する。

Q ss は窒素原子、炭素原子又は式 $>\text{N}\rightarrow\text{O}$ で示される基を意味する。

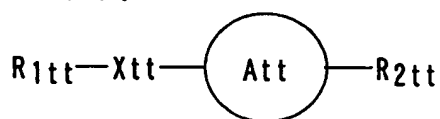
K ss は水素原子、置換若しくは無置換のフェニル基、フェニル基が置換され
 10 てもよいアリールアルキル基、フェニル基が置換されていてもよいシンナミル
 基、低級アルキル基、ピリジルメチル基、シクロアルキルアルキル基、アダマ
 ンタンメチル基、フリルメチル基、シクロアルキル基、低級アルコキシカルボ
 ニル基又はアシル基を意味する。

q ss は 1 ~ 3 の整数を意味する。

15 式中、 $---$ は単結合若しくは二重結合を意味する。〕で表される化合物又
 はその塩。具体例としては、1-ベンジル-4-〔(5, 6-ジメトキシ-1-
 インドノン)-2-イル〕メチルピペリジン、N-〔4'-(1'-ベンジ
 ルピペリジル)エチル〕-2-キノキサリンカルボン酸アミド、4-〔4'-(
 (N-ベンジル)ピペリジル)-p-メトキシブチロフェノン、1-〔4'-(
 20 1'-ベンジルピペリジン)エチル〕-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-5H-
 1-ベンツアゼピン-2-オン等が挙げられる。

上記化合物又はその塩は、特開昭64-79151号公報(USP 4, 89
 5, 841)に記載の方法又はそれに準じた方法により製造される。

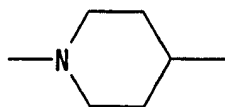
21) 式



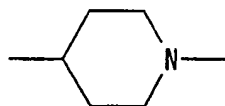
〔式中、 $\text{R}_{1\text{tt}}$ は、置換基を有していてもよいベンゼン、ピリジン、ピラジン
 、インドール、アントラキノン、キノリン、置換基を有していてもよいフター
 ルイミド、ホモフタールイミド、ピリジンカルボン酸イミド、ピリジン-N-
 オキサイド、ピラジンジカルボン酸イミド、ナフタレンジカルボン酸イミド、

- 置換基を有していてもよいキナゾリジンジオン、1, 8-ナフタールイミド、
 ビシクロ[2. 2. 2]オクト-5-エン-2, 3-ジカルボン酸イミド及びピロ
 メールイミドから選ばれるものから誘導される一価の基；X₁₁は式 $-(CH_2)$
 $m_{11}-$ （式中、 m_{11} は0～7の整数を示す）で示される基、式 $-O(CH_2)$
 5 $n_{11}-$ で示される基、式 $-S(CH_2)n_{11}-$ で示される基、式 $-NH(CH_2)n_{11}-$ で示される基、式 $-SO_2NH(CH_2)n_{11}-$ で示される基、式
 $-NHCO(CH_2)n_{11}-$ で示される基、式 $-NH(CH_2)n_{11}-CO-$ で
 示される基、式 $-COO(CH_2)n_{11}-$ で示される基、式 $-CH_2NH(CH_2)$
 $n_{11}-$ で示される基、式 $-CONR_{3,11}-(CH_2)n_{11}-$ で示される基
 10 （X₁₁の定義中、これまでの式で n_{11} はいずれも1～7の整数、 $R_{3,11}$ は低
 級アルキル又はベンジル基を意味する）、式 $-O-CH_2CH_2CH(CH_3)-$
 で示される基、式 $-O-CH(CH_3)CH_2CH_2-$ で示される基、式 $-O-$
 $CH_2CH_2CH=$ で示される基、式 $-O-CH_2CH(OH)CH_2-$ で示さ
 れる基；環A₁₁は式

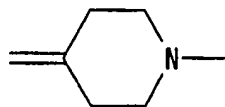
15



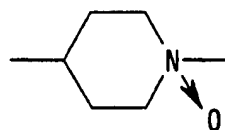
で示される基、式



で示される基、式

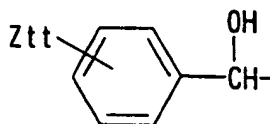


20 で示される基、又は式



で示される基； $R_{2,11}$ は水素原子、低級アルキル基、置換基を有していてもよ

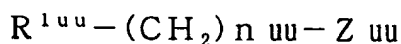
いベンジル基、置換基を有していてもよいベンゾイル基、ピリジル基、2-ハイドロキシエチル基、ピリジルメチル基、又は式



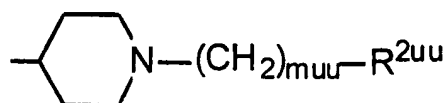
(式中、Z tt はハロゲン原子を意味する) で表される基を示す。) で表される化合物又はその塩。具体例としては、N-メチル-N-[2-(1'-ベンジルピペリジン-4'-イル)エチル]-4-ベンジルスルホニルベンツアミド、N-[2-(N'-ベンジルピペリジン-4'-イル)エチル]-4-ニトロフタールイミド、N-[2-(N'-ベンジルピペリジン-4'-イル)エチル]-1,8-ナフタールイミド等が挙げられる。

上記化合物又はその塩は、特開昭62-234065号公報(E P-A-229391)に記載の方法又はそれに準じた方法により製造される。

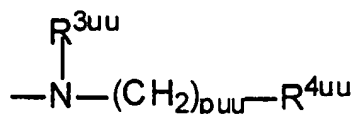
22) 式



(式中、 R^{1uu} は置換基を有していてもよい環状アミド化合物から誘導される基； nuu は0又は1～10の整数； Z_{uu} は、①式



(式中、 R^{2uu} は置換基を有していてもよいアリール基、シクロアルキル基又は複素環基； muu は1～6の整数を意味する) で示される基、又は②式

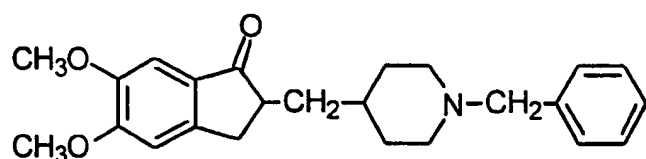


(式中、 R^{3uu} は水素原子又は低級アルキル基； R^{4uu} は置換基を有していてもよいアリール基、シクロアルキル基又は複素環基； puu は1～6の整数を意味する) で示される基を意味する。但し、 R^{1uu} の定義における置換基を有していてもよい環状アミド化合物がキナゾリジン-オン又はキナゾリジン-ジオンである場合、 Z_{uu} の定義において、 R^{2uu} 及び R^{4uu} がアリール基である場合は除く。) で表される化合物又はその塩。具体例としては、3-[2-(1-ベ

ンジル-4-ピペリジル) エチル] - 5-メトキシ-2H-3, 4-ジヒドロ-1, 3-ベンツオキサジン-2-オン、3-[2-[1-(4-ピリジルメチル)-4-ピペリジル] エチル] - 2H-3, 4-ジヒドロ-1, 3-ベンツオキサジン-2-オン、3-[2-[1-(1, 3-ジオキサラン-2-イルメチル)-4-ピペリジル] エチル] - 5-メトキシ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロキナゾリン-2, 4-ジオン、3-[2-(1-ベンジル-4-ピペリジル) エチル] - 6-メトキシ-2H-3, 4-ジヒドロ-1, 3-ベンツオキサジン-2, 4-ジオン等が挙げられる。

上記化合物又はその塩は、特開平4-235161号公報(E P-A-468187)に記載の方法又はそれに準じた方法により製造される。

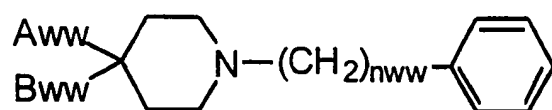
23) 式



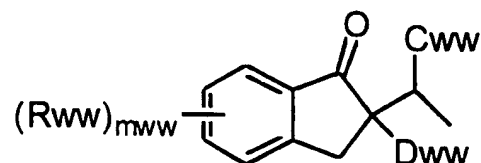
で表される光学活性インダノン誘導体又はその塩。

上記化合物又はその塩は、特開平4-21670号公報に記載の方法又はそれに準じた方法により製造される。

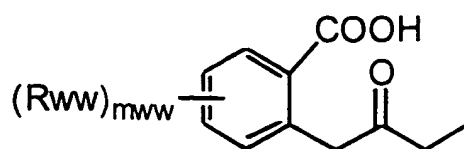
24) 式



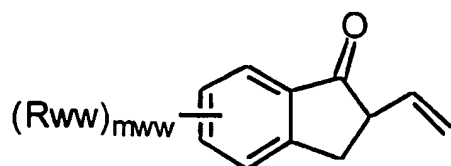
〔式中、n wwは0又は1～2の整数；A wwは式



(式中、C wwは水素原子又はヒドロキシ基；D wwは水素原子又は低級ヒドロキシアシル基；R wwは同一又は異なって水素原子、低級アルキル基及び低級アルコキシ基から選ばれる基；m wwは0又は1～4の整数を意味する) で表される基、又は式



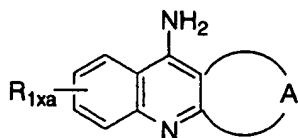
(式中、各記号は前記と同意義)で表される基; B_{ww} は水素原子又はヒドロキシ基を示し; A_{ww} と B_{ww} が二重結合を形成し、式



- 5 (式中、各記号は前記と同意義)で表される基を形成してもよい。)で表される化合物又はその塩。具体例としては、1-ベンジル-4-(5, 6-ジメトキシ-1-インダノン-2-イル)ヒドロキシメチルピペリジン、1-ベンジル-4-(5, 6-ジメトキシ-2-ヒドロキシメチル-1-インダノン-2-イル)メチルピペリジン、1-ベンジル-4-[3-(4, 5-ジメトキシ-2-カルボキシフェニル)-2-オキソ]プロピルピペリジン等が挙げられ
- 10 る。

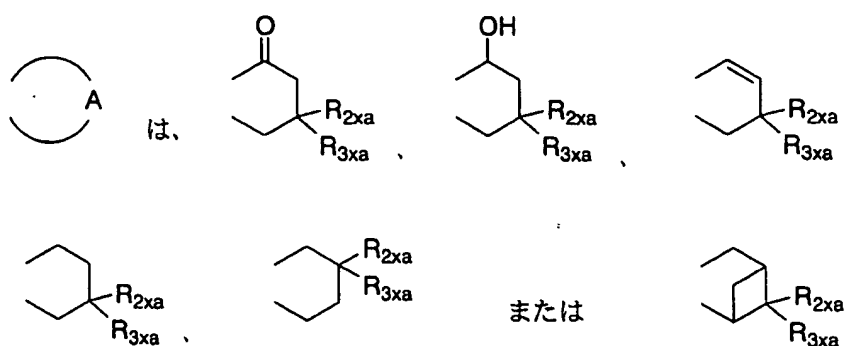
上記化合物又はその塩は、特開平9-268176号公報に記載の方法又はそれに準じた方法により製造される。

25) 式



- 15 [式中、R_{1xa} は水素、ハロゲン、ヒドロキシ基、低級アルコキシ基、低級アルキル基又はモノ(又はジ又はトリ)ハロ(低級)アルキル基、

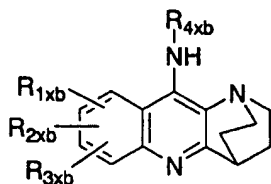
81



(式中、 R_{2xa} 及び R_{3xa} はそれぞれ低級アルキル基を意味する。)を意味する。
 5]で表される化合物又はその塩。具体例としては、9-アミノ-6-クロロ-3,3-ジメチル-1,2,3,4-テトラヒドロアクリジン等が挙げられる。

上記化合物又はその塩は、特開平2-167267号公報に記載の方法又はそれに準じた方法により製造される。

26) 式



10 [式中、 R_{1xb} 、 R_{2xb} 及び R_{3xb} はそれぞれ水素原子、ハロゲン原子、トリフルオロメチル基、低級アルキル基、低級シクロアルキル基、低級アルコキシ基、低級アルコキシメチル基、低級アルキルチオ基、ニトロ基、アミノ基、低級アルカノイルアミノ基、低級アルキルアミノ基、ヒドロキシル基、フェニル基又はハロゲン原子、低級アルキル基若しくは低級アルコキシ基で置換されたフェニル基を表わし、

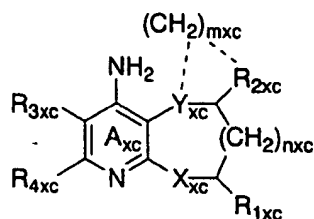
15 R_{4xb} は水素原子、低級アルキル基、アラルキル基、ジアラルキル基、又は式 $R_{5xb}-CO-$

で表される基(R_{5xb} は低級アルキル基、低級シクロアルキル基、アラルキル基、フェニル基又はハロゲン原子、低級アルキル基若しくは低級アルコキシ基で置換されたフェニル基を表わす。)を表わす。]
 20]で表されるアミノアザアクリジン誘導体又はその塩。具体例としては、9-アミノ-8-フルオロ-1,2

、3, 4-テトラヒドロ-1, 4-エタノ-1-アザアクリジン等が挙げられる。

上記化合物又はその塩は、特開昭63-166881号公報に記載の方法又はそれに準じた方法により製造される。

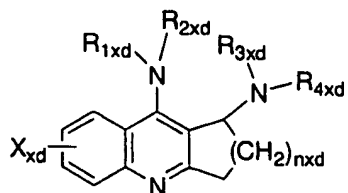
5 27) 式



〔式中、 R_{1xc} は、水素原子又は低級アルキル基を、 R_{2xc} は独立して水素原子若しくは、低級アルキル基を示すか、又は R_{6xc} と一緒に環状のアルキレン鎖を示す。 R_{3xc} 及び R_{4xc} は、独立して各々水素原子を示すか、又は一緒になって環 A_{xc} とともにキノリン環若しくは、テトラヒドロキノリン環を構成する。 X_{xc} は酸素原子、硫黄原子又は $N-R_{5xc}$ を示し、 R_{5xc} は水素原子、又は低級アルキル基を示す。 Y_{xc} は酸素原子又は $N-R_{6xc}$ を示し、 R_{6xc} は独立して、水素原子若しくは低級アルキル基を示すか、又は R_{2xc} と一緒に環状アルキレンを示す。 nxc は0又は1を、 $mx c$ は0～4の整数を示す。〕で表される化合物又はその塩。具体的には、4'-アミノキノリノ〔2, 3-b〕-4-メチル-5, 6-ジヒドロ-1, 4-オキサジンや4'-アミノ-5, 6, 7, 8-テトラヒドロキノリノ〔2, 3-b〕-4-メチル-5, 6-ジヒドロ-1, 4-オキサジン等が挙げられる。

上記化合物又はその塩は、特開平2-96580号公報に記載の方法又はそれに準じた方法により製造される。

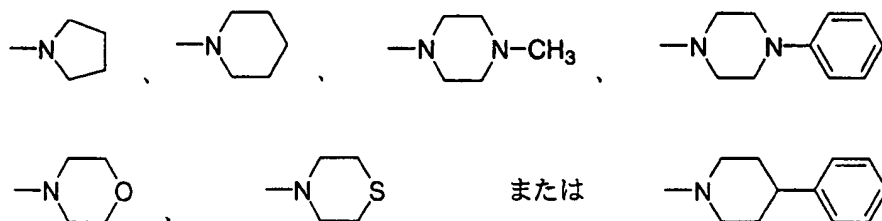
20 28) 式



〔式中、 nxd は1, 2又は3であり、 Xxd は水素、低級アルキル、低級アルコキシ、ハロゲン、ヒドロキシ、ニトロ又はトリフルオロメチルであり；

R_{1xd} 及び R_{2xd} はそれぞれ独立して水素、低級アルキル又はアリール低級アルキルであるが、しかし両者は同時にアリール低級アルキルであることはできないものであり；

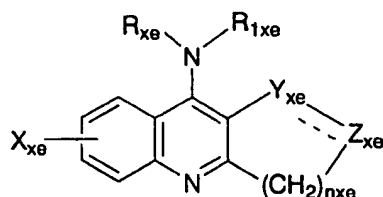
- 5 R_{3xd} 及び R_{4xd} はそれぞれ独立して水素、低級アルキル、アリール低級アルキル、ホルミル又は低級アルキルカルボニルであるか又は基 $-NR_{3xd}R_{4xd}$ が全体として次の基



- を構成する。] で表される化合物、その立体異性体又はその塩。具体的には、
 1 - (1-ピペリジニル) - 1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-9-アクリジナ
 10 ジアミン等が挙げられる。

上記化合物又はその塩は、特開平 3 - 1 5 3 6 6 7 号公報に記載の方法又はそれに準じた方法により製造される。

29) 式

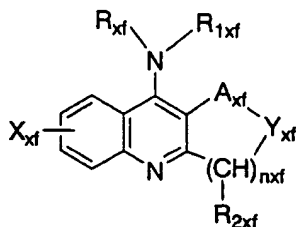


- [式中、 n_{xe} は 1, 2 又は 3 であり、 X_{xe} は水素、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_1 \sim C_6$ -アルコキシ、ハロゲン、ヒドロキシ、ニトロ、トリフルオロメチル、
 15 $NHCO R_{2xe}$ (ここで R_{2xe} は $C_1 \sim C_6$ -アルキルである) 又は $NR_{3xe}R_{4xe}$ (ここで R_{3xe} 及び R_{4xe} は独立して水素又は $C_1 \sim C_6$ -アルキルである) であり、
 R_{xe} は水素又は $C_1 \sim C_6$ -アルキルであり、 R_{1xe} は水素、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、ジ- $C_1 \sim C_6$ -アルキルアミノ- $C_1 \sim C_6$ -アルキル、アリール- $C_1 \sim C_6$ -アルキル、
 20 ジアリール- $C_1 \sim C_6$ -アルキル、フリル- $C_1 \sim C_6$ -アルキル、チエニル- $C_1 \sim C_6$ -アルキル、酸素架橋されたアリール- $C_1 \sim C_6$ -アルキル、酸素架橋されたジアリール- $C_1 \sim C_6$ -アルキル、酸素架橋され

たフリル- $C_1 \sim C_6$ -アルキル、又は酸素架橋されたチエニル- $C_1 \sim C_6$ -アルキルであり、 Y_{xe} は $C=O$ 又は $CR_{5xe}OH$ （ここで R_{5xe} は水素又は $C_1 \sim C_6$ -アルキルである）であり、そして Z_{xe} は CH_2 又は $C=CR_{6xe}R_{7xe}$ （ここで R_{6xe} 及び R_{7xe} は独立して水素又は $C_1 \sim C_6$ -アルキルである）であるか、
 5 又は Y_{xe} と Z_{xe} が一緒になって $CR_{5xe}=CH$ （ここで CR_{5xe} 及び CH はそれぞれ Y_{xe} と Z_{xe} に対応する）を構成するものとする。］で表される化合物、その光学対掌体又はその塩。具体的には、9-アミノ-3,4-ジヒドロアクリジン-1(2H)-オン又は9-アミノ-1,2,3,4-テトラヒドロアクリジン-1-オール等が挙げられる。

10 上記化合物又はその塩は、特開昭61-148154号公報又は特告平5-41141号公報に記載の方法又はそれに準じた方法により製造される。

30) 式



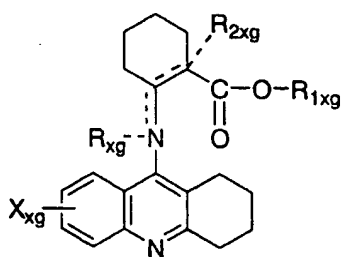
〔式中、 n_{xf} は1~4であり； R_{xf} は水素、低級アルキル又は低級アルキルカルボニルであり； R_{1xf} は水素、低級アルキル、低級アルキルカルボニル、
 15 アリール、ジ低級アルキルアミノ低級アルキル、アリール低級アルキル、ジアリール低級アルキル、酸素架橋されたアリール低級アルキル、又は酸素架橋されたジアリール低級アルキルであり； A_{xf} は直接の結合又は $(CHR_{3xf})_{m_{xf}}$ であり； m_{xf} は1~3であり； X_{xf} は水素、低級アルキル、シクロアルキル、低級アルコキシ、ハロゲン、ヒドロキシ、ニトロ、トリフルオロメチル、ホルミル、低級アルキルカルボニル、アリールカルボニル、-SH、低級
 20 アルキルチオ、-NHCOR_{4xf}又はNR_{5xf}R_{6xf}であり、上記式中 R_{4xf} は水素又は低級アルキルであり、 R_{5xf} 及び R_{6xf} は各々独立して水素、低級アルキル又はシクロアルキルであり； Y_{xf} はO、S又はNR_{7xf}であり；各 R_{2xf} 、各 R_{3xf} 及び R_{7xf} は独立して水素若しくは低級アルキルであるか、又は2つが同時に、
 25 、少なくとも5つの原子からなる環の一部をなすメチレン若しくはエチレン基を形成し；但し A_{xf} が CH_2 で、 Y_{xf} が NCH_3 で、 $(CHR_{2xf})_{n_{xf}}$ が

CH₂CH₂で、X_{x f}がH、CH₃、Cl、Br又はNO₂で、R_{xf}がHである場合には、R_{ixf}はH、メチル、エチル、プロピル、ブチル又はベンジルではなく；A_{x f}が-CH₂-又はCHR[′]-で、Y_{x f}がNH又はNR[′]で、(CHR_{2xf})_{n x f}が-CH₂CH₂-又はCH₂CHR[′]-である場合には、基-NR_{xf}R_{ixf}は-NH₂、-NHC₆H₅又はジ低級アルキルアミノ低級アルキルアミノではなく、各R[′]は独立して低級アルキルであり；A_{x f}がCH₂で、Y_{x f}がNH又はNR[′]で、(CHR_{2xf})_{n x f}が-(CH₂)₃-又はCHR[′]CH₂CH₂-である場合には、基-NR_{xf}R_{ixf}は-NH₂ではなく；A_{x f}が-CH₂CH₂-で、Y_{x f}がNH又はNR[′]で、(CHR_{2xf})_{n x f}が-C

5 H₂CH₂-又はCHR[′]CH₂-である場合には、基-NR_{xf}R_{ixf}は-NH₂ではない。]で示される化合物、その立体、光学若しくは幾何異性体又はその塩。具体的には、9-アミノ-2, 3-ジヒドロチエノ[3, 2-b]キノリン又は10-アミノ-3, 4-ジヒドロ-1H-チオピラノ[4, 3-b]キノリン等が挙げられる。

15 上記化合物又はその塩は、特開昭63-284175号公報に記載の方法又はそれに準じた方法により製造される。

31) 式



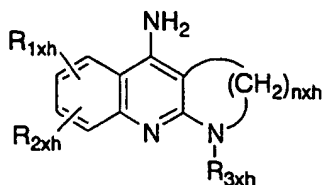
[式中、X_{x g}は水素、低級アルキル、低級アルコキシ又はハロゲンであり；R_{xg}は、存在する場合には、水素、低級アルキル又はアリール低級アルキルであり；R_{ixg}は、水素、低級アルキル又はアリール低級アルキルであり；そしてR_{2xg}は、存在する場合には、水素又は低級アルキルである。]で表される化合物又はその塩。具体的には、2-(1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-9-アクリジンイミノ)-シクロヘキサンカルボン酸や2-(1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-9-アクリジンイミノ)-シクロヘキサンカルボン酸エチルエステル

20 等が挙げられる。

25

上記化合物又はその塩は、特開平 3 - 9 5 1 6 1 号公報に記載の方法又はそれに準じた方法により製造される。

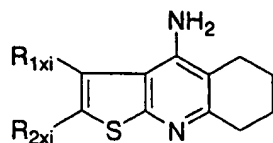
3 2) 式



- [式中、 R_{1xh} 及び R_{2xh} はそれぞれ水素原子、ハロゲン原子、低級アルキル基、トリフルオロメチル基、ヒドロキシル基、低級アルコキシ基、低級アルカノイルオキシ基、ニトロ基、アミノ基又は低級アルカノイルアミノ基を表わし、 R_{3xh} は、水素原子；炭素数 1 ～ 15 のアルキル基；シクロアルキル基；ハロゲン、低級アルキル基若しくは低級アルコキシで置換されていてもよい炭素数 7 ～ 15 のアラルキル基；炭素数 2 ～ 15 のアルカノイル基；又はハロゲン、低級アルキル、低級アルコキシ、ニトロ、ヒドロキシル若しくはアミノで置換されていてもよいベンゾイル基を表わし、 $n \times h$ は 2 ～ 5 の整数を表わす。] で示される化合物又はその塩。具体的には、6-アミノ-1-ベンジル-2, 3, 4, 5-テトラヒドロ-1H-アゼピノ [2, 3-b] キノリンや5-アミノ-6-フルオロ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロベンゾ [d] [1, 8] ナフチリジンが挙げられる。

上記化合物又はその塩は、特開平 3 - 2 2 0 1 8 9 号公報に記載の方法又はそれに準じた方法により製造される。

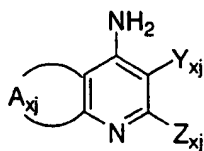
3 3) 式



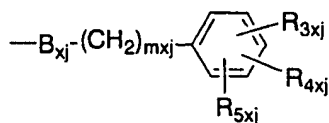
- [式中、 R_{1xi} 、 R_{2xi} はそれぞれ水素原子、炭素数 1 ～ 4 の直鎖及び分枝アルキル基を表わす。但しともに水素原子となることはない。] で示される4-アミノ-5, 6, 7, 8-テトラヒドロチエノ [2, 3-b] キノリン誘導体又はその塩。具体的には、4-アミノ-2, 3-ジメチル-5, 6, 7, 8-テトラヒドロチエノ [2, 3-b] キノリン等が挙げられる。

上記化合物又はその塩は、特開平 4 - 1 3 4 0 8 3 号公報に記載の方法又はそれに準じた方法により製造される。

3 4) 式

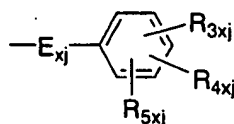


- [式中、 A_{xj} は式 $-(CH_2)_{n_{xj}}-$ (但し n_{xj} は 3 ~ 5 の整数である
 5) のアルキレン基を表わして、これに隣接するピリジン核の隣り合う 2 個の炭素原子に結合して 1 個のシクロアルケノ基を形成するか、若しくは A_{xj} はこれに隣接するピリジン核の隣り合う 2 個の炭素原子と連合して 1 個のベンゼン環を形成する基であり、そして (i) A_{xj} がシクロアルケノ基を形成する場合には Y_{xj} は水素原子、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ の低級アルキル基又はア
 10 ミノ基を表わし、かつ Z_{xj} は水素原子、水酸基、ハロゲン原子、アミノ基、式 $-NR_{1xj}R_{2xj}$ (R_{1xj} 、 R_{2xj} は同一でも異なってもよく、低級アルキル基又はベンジル基を表わす) の基、ピロリジル基、ピペリジル基、ピペラジル基、 N -置換ピペラジル基、ピリジル基又は次式



15

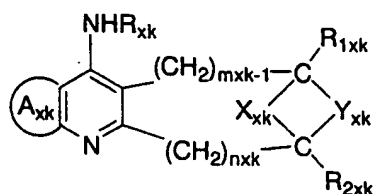
- (式中、 B は酸素原子又は硫黄原子を示し、 m_{xj} は 0 ~ 2 の整数を示し、 R_{3xj} 、 R_{4xj} 、 R_{5xj} は同一でも異なってもよく水素原子、ハロゲン原子、トリフルオロメチル基、水酸基、低級アルコキシ基、直鎖又は分枝の ($C_1 \sim C_6$) 低級アルキル基、アミノ基、アシルアミノ基を表わす) の基を示すか又は Z_{xj}
 20 j はピリジルチオ基の基を示し、また (ii) A_{xj} がベンゼン環を形成する場合には、 Y_{xj} は水素原子又は $C_1 \sim C_6$ の低級アルキル基を示しかつ Z_{xj} は式 $-CONR_{6xj}R_{7xj}$ (但し R_{6xj} 及び R_{7xj} はそれぞれ水素原子又は $C_1 \sim C_6$ の低級アルキル基を表わし、あるいは R_{6xj} 及び R_{7xj} は共同して $C_3 \sim C_6$ のシクロアルキル基を形成する) の基を示すか、又は Z_{xj} は式



- (式中、 E_{xj} は $C_2 \sim C_6$ のアルキレン基又は式 $-(CH=CH)_{p_{xj}}-$ (但し p_{xj} は1又は2を表わす)の基を示し、 R_{3xj} 、 R_{4xj} 及び R_{5xj} は前期の意味を表わす)の基を示す。]で表される4-アミノ-2, 3-シクロアルケノピリジン及び4-アミノキノリン誘導体又はそれらの塩。具体的には、4-アミノ-2-(N-メチルカルバモイル)キノリン等が挙げられる。

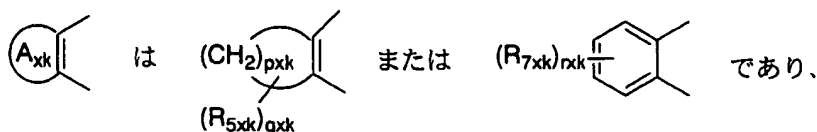
上記化合物又はその塩は、特開平4-66571号公報に記載の方法又はそれに準じた方法により製造される。

10 35) 式



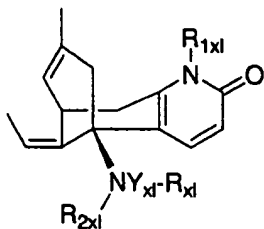
- [式中、 R_{xk} は水素、アルキル、アラルキル又はアシルであり、 R_{1xk} 及び R_{2xk} は、独立して、水素、アルキル、アラルキル、アルコキシ、アルコシカルボニル、アミノ又は1又は2個のアルキル、アラルキル又はアシル基で置換されたアミノであり、 m_{xk} 及び n_{xk} は1、2又は3の値であり、 X_{xk} 及び Y_{xk} は、独立して、2個の炭素間の結合、酸素又は硫黄原子、基 $N-R_{3xk}$ (式中基 R_{3xk} は R_{xk} について上記において定義した意味を有する)又は1～5個の炭素原子を含有しかつ1又は2以上の置換基 R_{4xk} を含有できるアルキレン又はアルケニレン架橋 (ここで R_{4xk} は、独立して、水素、1～4個の炭素原子を有する直鎖状若しくは分枝鎖状の低級アルキル、アルケニル又はアルキリデン、フェニル又は1又は2以上の1～4個の炭素原子を有する低級アルキル基、1～4個の炭素原子を有する低級アルコキシ基又はハロゲン基で置換された

- フェニル、アラルキル、1～4個の炭素原子を有する低級アルコキシ、及びヒドロキシルである)であり、そしてX x kがアルケニレン基であるとき、後者は飽和若しくは不飽和の炭素環式又は複素環式環系に融合することができ、前記環は1又は2以上の基R_{5xk}(R_{5xk}は水素、1～4個の炭素原子を有する低級アルキル又は低級アルコキシ又はハロゲンである)で置換することができ、そして



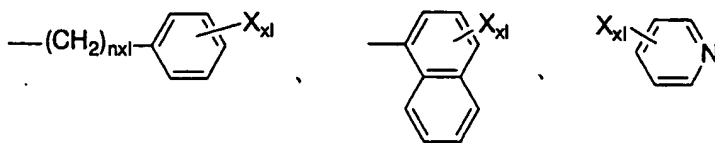
- p x k, q x k 及び r x k は1又は1より大きい値であり、そしてR_{6xk}又はR_{7xk}は、独立して、水素、ハロゲン、低級アルコキシ又は低級アルキルであることができる置換基である。] の多環式アミノピリジン化合物又はその塩。具体的には、(+)-12-アミノ-6, 7, 10, 11-テトラヒドロ-9-エチル-7, 11-メタノシクロオクタ [b] キノリンや(+)-12-アミノ-6, 7, 10, 11-テトラヒドロ-9-メチル-7, 11-メタノシクロオクタ [b] キノリン等が挙げられる。
- 上記化合物又はその塩は、特表平11-500144号公報に記載の方法又はそれに準じた方法により製造される。

36) 式

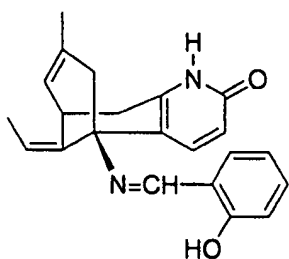


- [式中、Y_{xl}は-C=Oであるか、又は-R_{2xl}、Yは=CHであり、R_{xl}はC₁～C₅低級アルキル、

90

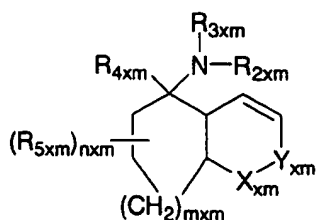


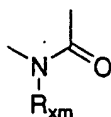
- (ここで、 $n \times 1 = 0$ 又は 1 であり、 X_{x1} は水素、 $C_1 \sim C_5$ 低級アルキル、 $C_1 \sim C_5$ 低級アルコキシ、ニトロ、ハロゲン、カルボキシ、アルコシカルボニル、ヒドロキシメチル、ヒドロキシ、ビス- $C_1 \sim C_5$ 低級アルキル置換アミノを表わす)、 $-(CH_2)_{m \times 1}COOZ_{x1}$ (ここで、 $m \times 1 = 0 \sim 5$ であり、 Z_{x1} は水素又は $C_1 \sim C_5$ 低級アルキルを表わす)、 $-CH=CH-G_{x1}$ 基 (ここで、 G_{x1} はフェニル、フラニル、カルボキシ、アルコシカルボニルを表わす)、及び窒素原子において $C_1 \sim C_5$ 低級アルキルにより置換されたジヒドロ若しくはテトラヒドロピリジルを表わし、 R_{1x1} は水素、 $C_1 \sim C_5$ 低級アルキル、ピリドイル及び $C_1 \sim C_5$ 低級アルコキシ置換ベンゾイルを表し、 R_{2x1} は水素及び $C_1 \sim C_5$ 低級アルキルを表わす。) で表される化合物又はその塩。具体的には、下式の化合物等が挙げられる。



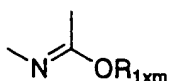
- 上記化合物又はその塩は、特表平 10-511651 号公報に記載の方法又はそれに準じた方法により製造される。

37) 式

[式中、 $X_{xm}-Y_{xm}$ は、式

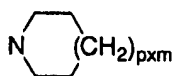


(式中、 R_{xm} は水素、低級アルキル、低級アルケニル、低級アルキニル又はアリーール低級アルキルである)の基、又は式

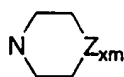


- 5 (式中、 R_{1xm} は水素、低級アルキル又はアリーール低級アルキルである)の基であり、 R_{2xm} 及び R_{3xm} は、独立して水素、低級アルキル、アリーール低級アルキル、ジアリーール低級アルキル、低級シクロアルケニル低級アルキル、低級アルコキシ、アリーール低級アルコキシ又は低級アルカノイルであるか、又は R_{2xm} 及び R_{3xm} は、これらが結合している窒素原子と一緒に式

10



(式中、 p_{xm} は0又は1である)の基、式

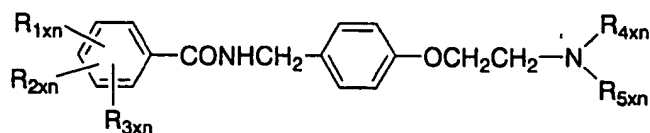


- (式中、 Z_{xm} はO、S又は式 NR_{6xm} (R_{6xm} は水素、低級アルキル又はアリーール低級アルキルである)の基である)の基を形成し、 R_{4xm} は水素、低級アルキル又はアリーール低級アルキルであり、 R_{5xm} は水素、低級アルキル又はアリーール低級アルキルであり、 m_{xm} は0、1又は2であり、そして n_{xm} は1又は2である。]の化合物、その幾何学的及び光学的異性体又はその塩。具体的には、N-(1, 2, 5, 6, 7, 8-ヘキサヒドロ-5-メチル-2-オキソ-5-キノリニル)アセトアミドや5-[[2-(3, 4-ジクロロフェニル)エチル]アミノ]-5, 6, 7, 8-テトラヒドロ-1-メチル-2(1H)-キノリノン等が挙げられる。
- 15
- 20

上記化合物又はその塩は、特開平4-290872号公報に記載の方法又は

それに準じた方法により製造される。

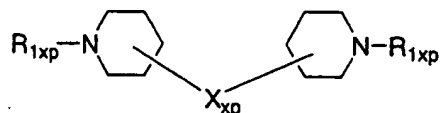
3.8) 式



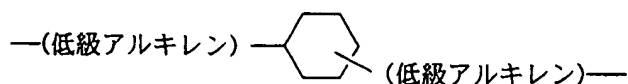
- 〔式中、 R_{1xn} 、 R_{2xn} 及び R_{3xn} はそれぞれ水素原子；低級アルキル基、低級アルコキシ基、水酸基、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、低級アルキル基が置換していても良いアミノ基、低級アルキル基が置換していても良いスルファモイル基を表わすか、若しくは R_{1xn} 及び R_{2xn} がいっしょになってメチレンジオキシ基を表わし、 R_{4xn} 及び R_{5xn} はそれぞれ低級アルキル基又は炭素数3から6個のシクロアルキル基、若しくは R_{4xn} 及び R_{5xn} がいっしょになってその置換する窒素原子と共に、それぞれ低級アルキル基が置換していても良い1-ピロリジニル基、1-ピペリジニル基、1-ピペラジニル基、4-モルホリニル基を表わす。〕で示される化合物又はその塩。具体的には、N-〔4-〔2-(ジメチルアミノ)エトキシ〕ベンジル〕-2-エトキシベンズアミドや4-アミノ-N-〔4-〔2-(ジメチルアミノ)エトキシ〕ベンジル〕-2-メトキシ-5-スルファモイルベンズアミド等が挙げられる。

上記化合物又はその塩は、特開平2-231421号公報に記載の方法又はそれに準じた方法により製造される。

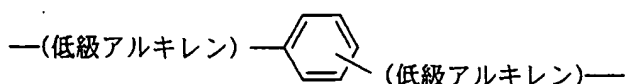
3.9) 式



- 〔式中、 X_{xp} は炭素数1～10の直鎖又は分枝状のアルキレン、



又は、

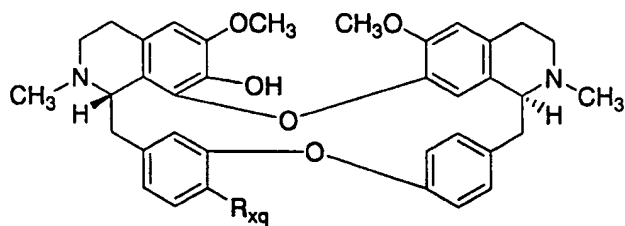


を表わす。

- R_{1xp} は $Ar \times p - CHR_{2xp} -$ （但し $Ar \times p$ は無置換のフェニル基又はハロゲン原子、トリフルオロメチル基、低級アルキル基若しくは低級アルコキシ基で置換されたフェニル基を表わし、 R_{2xp} は水素原子又は低級アルキル基を表わす。）、フェニル基が無置換又はハロゲン原子、低級アルキル基若しくは低級アルコキシ基で置換されたシンナミル基、シクロアルキルメチル基又は複素環芳香族基で置換されたメチル基を表わす。また、 X の2つのピペリジン環への結合部位は一方が2位なら他方は2'位、一方が3位なら他方は3'位、一方が4位なら他方は4'位である。]で示される化合物又はその塩。具体的には、
- 1, 6-ジ-（1-ベンジル-4-ピペリジル）ヘキサンや1, 5-ジ-（1-ベンジル-4-ピペリジル）ペンタン等が挙げられる。

上記化合物又はその塩は、特開平4-18071号公報に記載の方法又はそれに準じた方法により製造される。

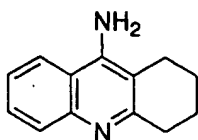
- 40) 式



[式中、 R_{xq} は水酸基又はメトキシ基を示す。]で示される化合物又はその塩。

上記化合物又はその塩は、特開平4-159225号公報に記載の方法又はそれに準じた方法により製造される。

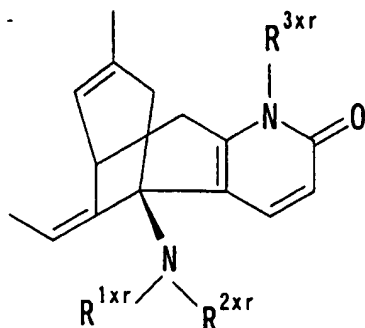
- 41) 下式で表される9-アミノ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロアクリジン又はその塩。



上記化合物又はその塩は、特開平4-346975号公報に記載の方法、該公報に引用された文献記載の方法、又はそれらに準じた方法により製造される。

。

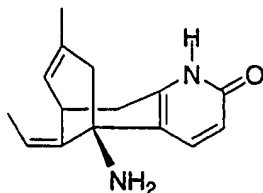
42) 式



5

[式中、 R^{1xr} 、 R^{2xr} 及び R^{3xr} はそれぞれ水素原子又は低級アルキル基を示す。]で表される化合物又はその塩。

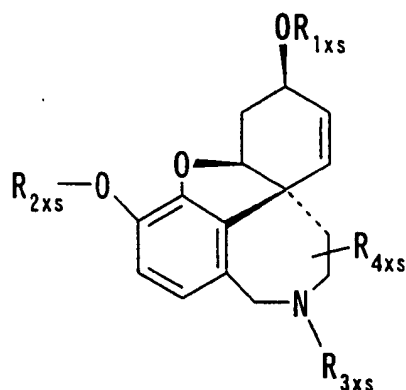
下式で表されるフベルジンA (Huperzine A) 又はその塩。



上記化合物又はその塩は、USP 5,177,082、J. Am. Chem. Soc. , 1991, 113, p4695-4696、又は、J. Am. Chem. Soc. , 1989, 111, p4116-4117 に記載の方法又はそれらに準じた方法により製造されるか、あるいは、中草药の千層塔(トウゲシバ)から抽出後、分離して得られる。

10

43) 下式の構造を有しているガランタミンあるいはガランタミンの誘導体

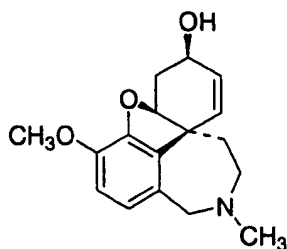


上式において R_{1xs} 及び R_{2xs} は同一のもの若しくは異なるものであり、それぞれ水素原子あるいは低級アルカノイル基のようなアシル基を意味しており、例えばアセチル基であり、あるいは例えばメチル、エチル、プロピル又はイソプロピル等の直鎖あるいは枝分かれたアルキル基である。

R_{3xs} は直鎖又は枝分かれたアルキル基、アルケニル基あるいはアルカリル(alkaryl)基であり、これらの基は任意にハロゲン原子、あるいはシクロアルキル基、水酸基、アルコキシ基、ニトロ基、アミノ基、アミノアルキル基、アシルアミノ基、ヘテロアリール基、ヘテロアリール-アルキル基、アロイル基、アロイルアルキル基、あるいはシアノ基により置き換えられるものであり、

R_{4xs} は四つの環状骨格を形成している炭素の少なくとも一つに結合している水素原子あるいはハロゲン原子を意味している。但し R_4 が窒素原子に隣接した位置に存在している場合は、 R_4 は好ましくはハロゲン原子、ならびに例えば臭化水素酸塩、塩酸塩等のハロゲンの塩、硫酸メチルあるいはメチオダイドとは異なるものであることを条件とする。

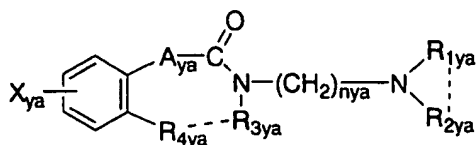
具体的には、下式で表されるGalanthamine又はその塩が挙げられる。



上記化合物又はその塩は、特表平6-507617号、Heterocycles, 1977, 8, p277-282、又は、J. Chem. Soc. (C), 1971, p1043-1047に記載の方法又

はそれに準じた方法により製造されるか、あるいは、*Galanthus nivalis* や *Galanthus waronowii* 等のユリ科植物から抽出後、分離して得られる。

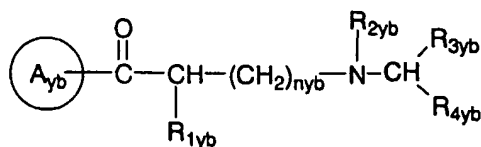
4 4) 式



- 5 〔式中、 R_{14a} と R_{24a} は、それぞれ独立して、水素原子又は、置換基を有していてもよい炭化水素残基を示すか、あるいは、隣接する窒素原子とともに縮合複素環基を形成し、 R_{34a} と R_{44a} は、 R_{34a} が水素原子又は、それぞれ置換基を有していてもよい炭化水素残基若しくはアシル基を示し、 R_{44a} が水素原子を示すか、あるいは、 R_{34a} と R_{44a} が結合して $-(CH_2)_{m4a}-CO-$ 、 $-CO-$
- 10 $(CH_2)_{m4a}-$ 又は $(CH_2)_{m4a+1}-$ (式中、 $m4a$ は0, 1又は2を示す) を形成し、 A_{4a} は $-(CH_2)_{l4a}-$ (式中、 $l4a$ は0, 1又は2を示す) 又は、 $-CH=CH-$ を示し、 X_{4a} は1以上の置換基を示し、 $n4a$ は4ないし7の整数を示す。〕で表わされる置換アミン類又はその塩。

- 15 上記化合物又はその塩は、特開平2-91052号公報に記載の方法又はそれに準じた方法により製造される。

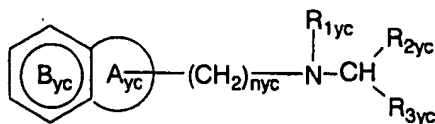
4 5) 式



- 20 〔式中、環 A_{5b} は置換されていてもよく、環構成ヘテロ原子としてO, S, Nの1~2個を含んでもよい5~8員環状基を示し、 R_{15b} は水素原子又は置換基を有していてもよい炭化水素残基を示し、 R_{25b} は水素原子又は低級アルキル基を示し、 R_{35b} は置換基を有していてもよい芳香族基を示し、 R_{45b} は水素原子又は低級アルキル基若しくは置換基を有していてもよい芳香族基を示し、 n_{5b} は2~7の整数を示す。〕で表されるアミノケトン誘導体又はその塩。

上記化合物又はその塩は、特開平3-95143号公報に記載の方法又はそれに準じた方法により製造される。

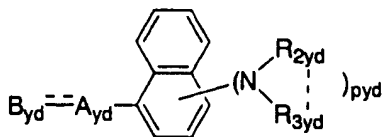
46) 式



- 〔式中、 R_{1yc} は水素原子又は低級アルキル基を示し、 R_{2yc} は置換基を有していてもよい芳香族基を示し、 R_{3yc} は水素原子又は低級アルキル基若しくは置換基を有していてもよい芳香族基を示し、 n_{yc} は0～7の整数を示し、環 A_{yc} は置換されていてもよく、環構成ヘテロ原子としてO、Sの1又は2個を含んでいてもよい5～8員環状基を示し、環 B_{yc} は置換されていてもよいベンゼン環を示す。〕で表されるアラルキルアミン誘導体又はその塩。

上記化合物又はその塩は、特開平3-141244号公報に記載の方法又はそれに準じた方法により製造される。

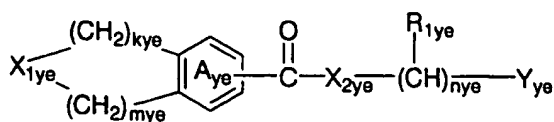
10 47) 式



- 〔式中、 B_{yd} は置換されていてもよい飽和又は不飽和の5～7員アザ複素環状基を示し、 A_{yd} は結合手又は炭化水素残基、オキソ基、ヒドロキシイミノ基若しくはヒドロキシ基で置換されていてもよい二価又は三価の脂肪族炭化水素残基を示し、 $---$ は単結合若しくは二重結合を示し（但し、 A_{yd} が結合手を表わすときは、 $---$ は単結合を表わす）、 R_{2yd} 、 R_{3yd} はそれぞれ独立して水素原子若しくは置換基を有していてもよい炭化水素残基を示すか又は、隣接する窒素原子とともに環状アミノ基を形成してもよく、 pyd は1又は2を示す。〕で表されるアミノナフタレン化合物又はその塩。

- 上記化合物又はその塩は、特開平3-223251号公報に記載の方法又はそれに準じた方法により製造される。

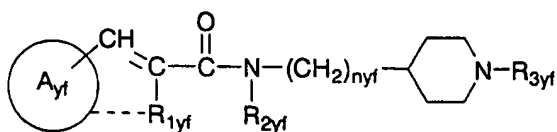
48) 式



- 〔式中、 X_{1ye} は $R_{4ye}-N$ (R_{4ye} は水素原子、置換基を有していてもよい炭化水素基又は置換基を有していてもよいアシル基を示す)、酸素原子又は硫黄原子を示し、 X_{2ye} は $R_{5ye}-N$ (R_{5ye} は水素原子、置換基を有していてもよい炭化水素基又は置換基を有していてもよいアシル基を示す) 又は酸素原子を示し、 A_{ye} 環は更に置換基を有していてもよいベンゼン環を示し、 R_{1ye} は水素原子、置換基を有していてもよい炭化水素基を示し、 R_{1ye} は nye の繰り返しにおいてそれぞれ異なってもよく、 Y_{ye} は置換されていてもよいアミノ基又は置換基を有していてもよい含窒素飽和複素環基を示し、 nye は1ないし10の整数を、 k_{ye} は0ないし3の整数を、 mye は1ないし8の整数を示す。〕で表される縮合複素環カルボン酸誘導体又はその塩。

上記化合物又はその塩は、特開平5-239024号公報に記載の方法又はそれに準じた方法により製造される。

49) 式



- 〔式中、環 A_{yf} は置換基を有していてもよい芳香環を示し、 R_{1yf} は水素原子又は置換基を有していてもよい炭化水素残基を示すか、あるいは隣接する基-CH=C-及び環 A_{yf} を構成する2個の炭素原子とともに置換されていてもよい炭素環を形成し、 R_{2yf} は水素原子又は置換基を有していてもよい炭化水素残基若しくはアシル基を示し、 R_{3yf} は置換基を有していてもよい炭化水素残基を示し、 nyf は2から6の整数を示す。〕で表わされる不飽和カルボン酸アミド誘導体又はその塩。

上記化合物又はその塩は、特開平2-138255号公報に記載の方法又はそれに準じた方法により製造される。

本発明で用いられる「アセチルコリンエステラーゼ阻害作用を有する非カル

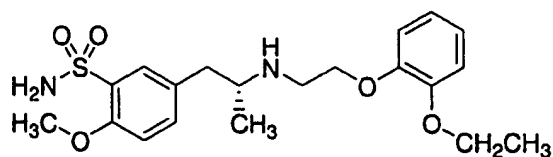
バメート系アミン化合物」として、好ましくは、化合物（I）が挙げられる。

本発明で用いられるアセチルコリンエステラーゼ阻害作用を有する非カルバメート系アミン化合物は、毒性も少なく、優れた膀胱筋収縮増強作用を有すると共に、尿道筋収縮作用を有しないことから、ヒト等の哺乳動物の膀胱排出力改善剤として使用することができる。例えば、以下の1) から6) 等に起因する排尿障害、特に排尿困難の予防・治療剤として使用することができる。1) 前立腺肥大症、2) 膀胱頸部閉鎖症、3) 神経因性膀胱、4) 糖尿病、5) 手術、及び6) 膀胱筋緊張低下。又、頻尿、尿失禁等の排尿障害にも用いることができる。

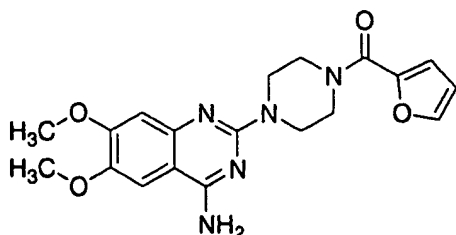
また、前立腺肥大症に伴う排尿障害、特に排尿困難の予防・治療剤として使用する場合、アセチルコリンエステラーゼ阻害作用を有する非カルバメート系アミン化合物と他の薬剤（例えば、タムスロシン等の α -遮断薬等）とを組み合わせ使用することができる。これらは、同時に用いても、また、別個製剤化したものを併用してもよい。

本発明化合物と組み合わせて使用することができる α -遮断薬として、具体的には、例えば、以下の化合物又はその塩が挙げられる。

ムスロシン (Tamsulosin) : EP-A-3 443 2, USP 4, 703, 063

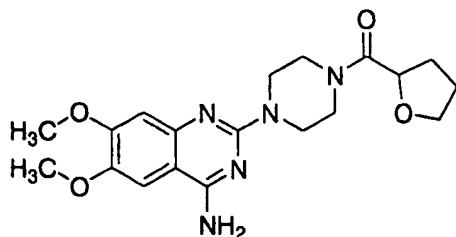


プラゾシン (Prazosin) : USP 3, 511, 836

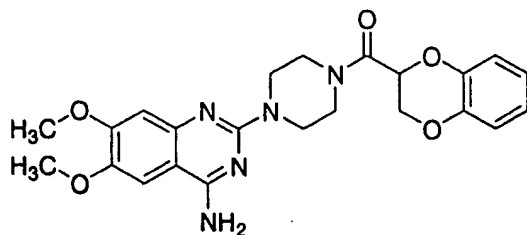


100

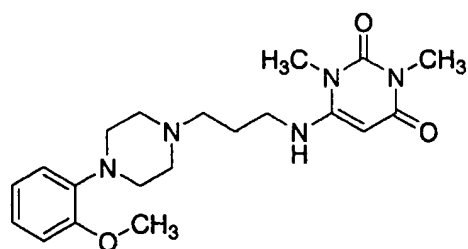
テラゾシン (Terazosin) : USP 4,026,894, USP 4,
2,51,532



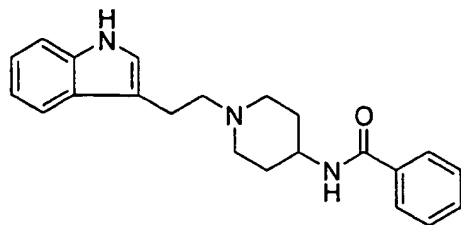
5 ドキサゾシン (Doxazosin) : USP 4,188,390



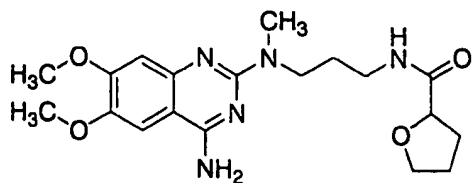
ウラピジル (Urapidil) : USP 3,957,786



インドラミン (Indoramin) : USP 3,527,761

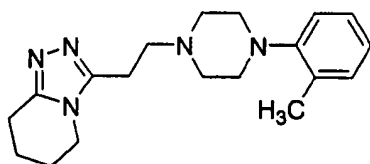


アルフゾシン (Alfuzosin) : USP 4,315,007

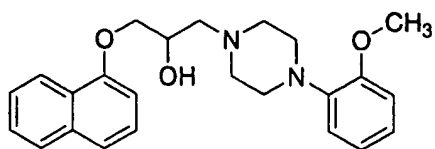


ダピプラゾール (Dapiprazole) : USP 4,252,721

5

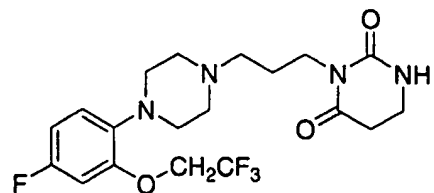


ナフトピジル (N a f t o p i d i l) : USP 3, 997, 666



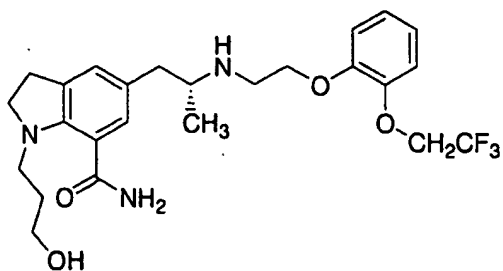
その他、以下の α -遮断薬も挙げられる。

10 R o 7 0 - 0 0 0 4

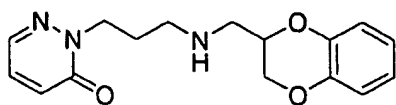


KMD-3213

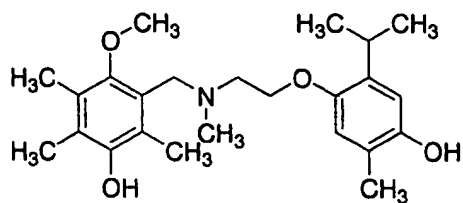
102



GYKI-16084

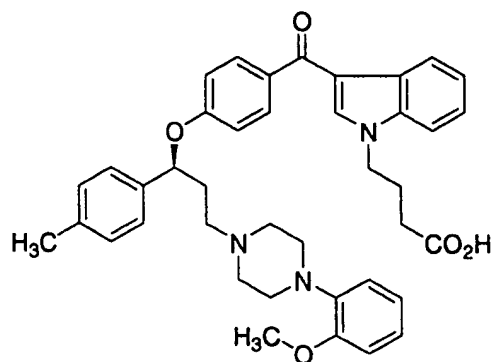


JTH-601



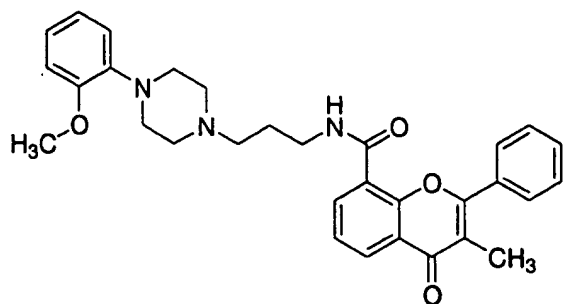
5

Z-350

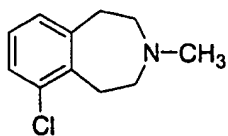


Rec-15-2739

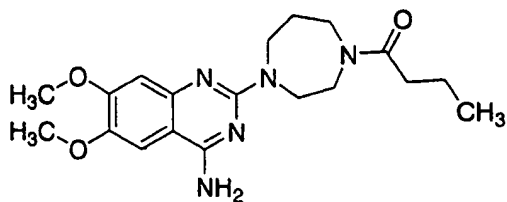
103



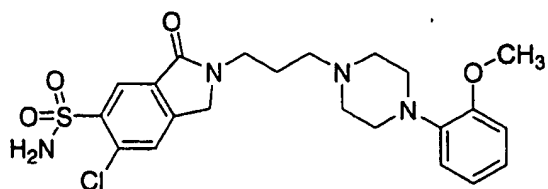
SK&F-86466



5 プナゾシン (Bunazosin) : USP 3,920,636



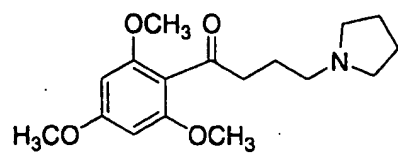
BMY-15037



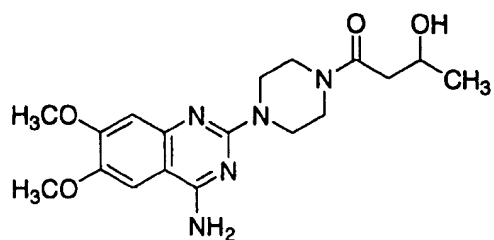
10

ブフロメジル (Buflomedil)

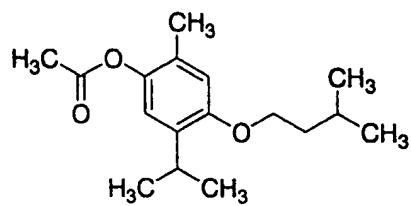
104



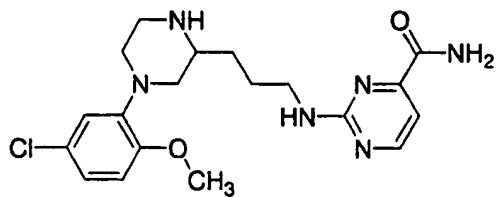
ネルダゾシン (Neldazosin)



5 Moxisylyte

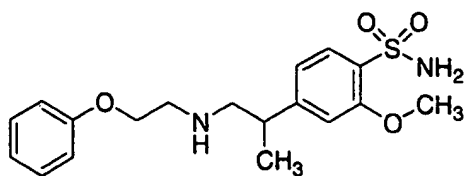


SL-890591



10

LY-23352



また、ABT-980, AIO-8507-L, L-783308, L-780945, SL-910893, GI-231818, SK&F-106686等の α -遮断薬も挙げられる。

- 5 本発明で用いられるアセチルコリンエステラーゼ阻害作用を有する非カルバメート系アミン化合物は、自体公知の手段に従って製剤化することができ、化合物そのまま、あるいは薬理学的に許容される担体を、製剤化工程において、適宜、適量混合することにより医薬組成物、例えば錠剤（糖衣錠、フィルムコーティング錠を含む）、散剤、顆粒剤、カプセル剤（ソフトカプセルを含む）
- 10 、液剤、注射剤、座剤、徐放剤等として、経口的又は非経口的（例、局所、直腸、静脈投与等）に安全に投与することができる。

- 本発明の膀胱排出力改善剤中、アセチルコリンエステラーゼ阻害作用を有する非カルバメート系アミン化合物の含有量は、剤全体の約0.1～約100重量%である。投与量は、投与対象、投与ルート、疾患等により異なるが、例え
- 15 ば、排尿困難治療剤として、成人（体重約60kg）に対して、経口剤として、1回当たり有効成分として約0.005～約100mg、好ましくは約0.05～約30mg、更に好ましくは約0.2～約10mgであり、1日1回の投与でもよいし、数回に分けて投与することもできる。

- 本発明の膀胱排出力改善剤の製造に用いられる薬理学的に許容される担体としては、製剤素材として慣用される各種有機又は無機担体物質が挙げられ、例
- 20 えば固形製剤における賦形剤、滑沢剤、結合剤、崩壊剤；液状製剤における溶剤、溶解補助剤、懸濁化剤、等張化剤、緩衝剤、無痛化剤等が挙げられる。また、必要に応じて、防腐剤、抗酸化剤、着色剤、甘味剤、吸着剤、湿潤剤等の添加物を用いることもできる。

- 25 賦形剤としては、例えば乳糖、白糖、D-マンニトール、デンプン、コーンスターチ、結晶セルロース、軽質無水ケイ酸等が挙げられる。

滑沢剤としては、例えばステアリン酸マグネシウム、ステアリン酸カルシウ

ム、タルク、コロイドシリカ等が挙げられる。

結合剤としては、例えば結晶セルロース、白糖、D-マンニトール、デキストリン、ヒドロキシプロピルセルロース、ヒドロキシプロピルメチルセルロース、ポリビニルピロリドン、デンプン、ショ糖、ゼラチン、メチルセルロース、

5 カルボキシメチルセルロースナトリウム等が挙げられる。

崩壊剤としては、例えばデンプン、カルボキシメチルセルロース、カルボキシメチルセルロースカルシウム、カルボキシメチルスターチナトリウム、L-ヒドロキシプロピルセルロース等が挙げられる。

溶剤としては、例えば注射用水、アルコール、プロピレングリコール、マクロゴール、ゴマ油、トウモロコシ油等が挙げられる。

10

溶解補助剤としては、例えばポリエチレングリコール、プロピレングリコール、D-マンニトール、安息香酸ベンジル、エタノール、トリスアミノメタン、コレステロール、トリエタノールアミン、炭酸ナトリウム、クエン酸ナトリウム等が挙げられる。

懸濁化剤としては、例えばステアリルトリエタノールアミン、ラウリル硫酸ナトリウム、ラウリルアミノプロピオン酸、レシチン、塩化ベンザルコニウム、塩化ベンゼトニウム、モノステアリン酸グリセリン等の界面活性剤；例えば

15 ポリビニルアルコール、ポリビニルピロリドン、カルボキシメチルセルロースナトリウム、メチルセルロース、ヒドロキシメチルセルロース、ヒドロキシエチルセルロース、ヒドロキシプロピルセルロース等の親水性高分子等が挙げら

20 れる。

等張化剤としては、例えばブドウ糖、D-ソルビトール、塩化ナトリウム、グリセリン、D-マンニトール等が挙げられる。

緩衝剤としては、例えばリン酸塩、酢酸塩、炭酸塩、クエン酸塩等の緩衝液

25 等が挙げられる。

無痛化剤としては、例えばベンジルアルコール等が挙げられる。

防腐剤としては、例えばパラオキシ安息香酸エステル類、クロロブタノール、ベンジルアルコール、フェネチルアルコール、デヒドロ酢酸、ソルビン酸等が挙げられる。

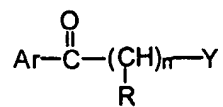
30 抗酸化剤としては、例えば亜硫酸塩、アスコルビン酸等が挙げられる。

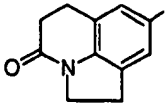
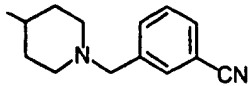
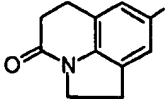
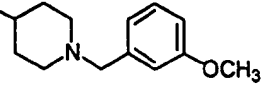
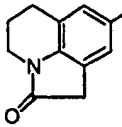
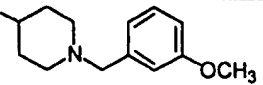
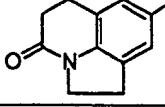
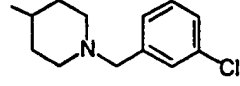
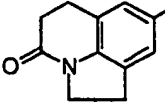
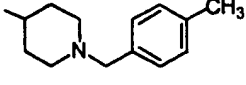
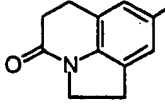
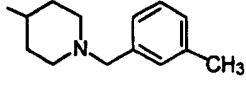
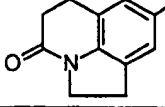
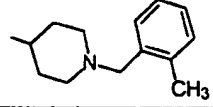
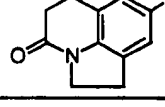
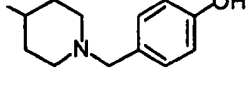
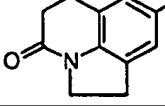
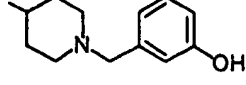
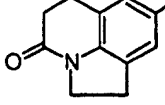
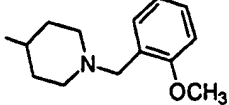
本発明は、更に以下の参考例、実施例、実験例及び製剤例によって詳しく説明されるが、これらの例は単なる実施例であって、本発明を限定するものではなく、また本発明の範囲を逸脱しない範囲で変化させてもよい。

5 参考例 1 - 3 0

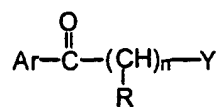
自体公知の方法に準じ、下記表に記載の参考例 1 - 3 0 の化合物を得た。

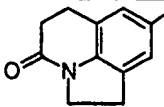
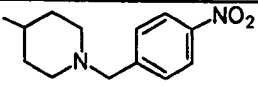
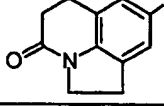
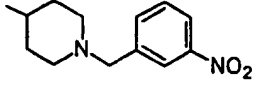
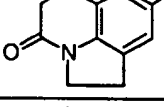
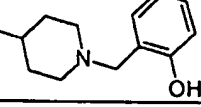
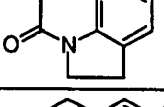
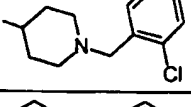
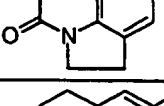
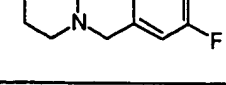
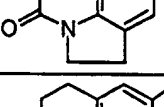
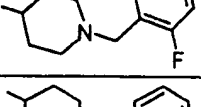
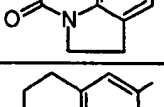
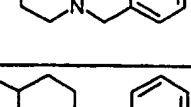
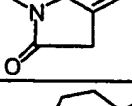
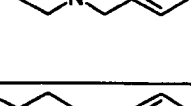
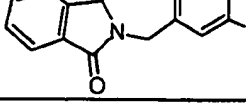
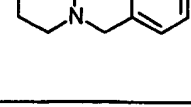
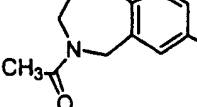
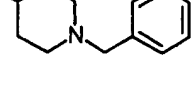
〔表 1〕



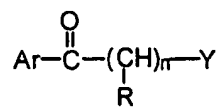
参考例番号	Ar	R	n	Y
1		H	2	
2		H	2	
3		H	2	
4		H	2	
5		H	2	
6		H	2	
7		H	2	
8		H	2	
9		H	2	
10		H	2	

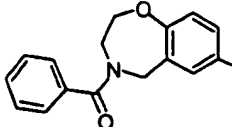
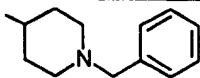
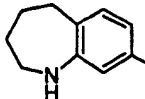
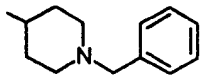
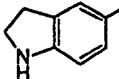
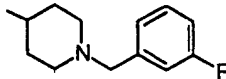
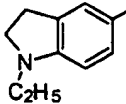
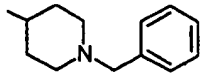
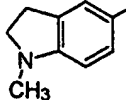
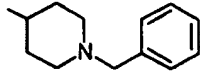
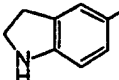
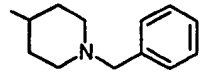
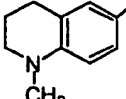
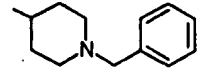
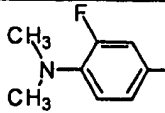
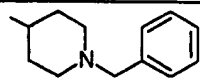
〔表 2〕



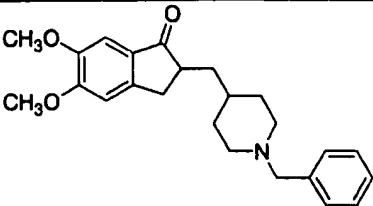
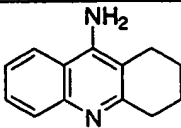
参考例番号	Ar	R	n	Y
1 1		H	2	
1 2		H	2	
1 3		H	2	
1 4		H	2	
1 5		H	2	
1 6		H	2	
1 7		H	2	
1 8		H	2	
1 9		H	2	
2 0		H	2	

〔表 3〕



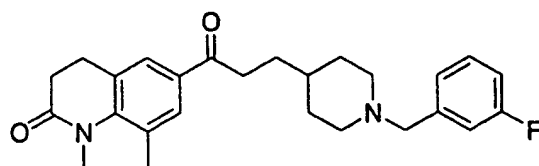
参考例番号	Ar	R	n	Y
2 1		H	2	
2 2		H	2	
2 3		H	2	
2 4		H	2	
2 5		H	2	
2 6		H	2	
2 7		H	2	
2 8		H	2	

〔表 4〕

参考例番号	
29	
30	

参考例 15-1

- 5 8-[3-[1-[(3-フルオロフェニル)メチル]-4-ピペリジニル]-1-オキソプロピル]-1,2,5,6-テトラヒドロ-4H-ピロロ[3,2,1-*ij*]キノリン-4-オン(参考例 15 の化合物)



- 1) 3-(1-アセチル-4-ピペリジニル)プロピオン酸 (88.2g, 0.443mol) を、氷冷下、塩化チオニル(300mL)に少量ずつ加えた。室温で10分間攪拌後、減圧下、25℃にて塩化チオニルを留去した。残査にジエチルエーテルを加え、減圧留去して黄色固形物を得た。更にジエチルエーテルを加え、固形物をスパーテルで粉砕し、減圧留去して、3-(1-アセチル-4-ピペリジニル)プロピオン酸クロリドの粗生成物を淡黄色粉末として得た。この淡黄色粉末及び1,2,5,6-テトラヒドロ-4H-ピロロ[3,2,1-*ij*]キノリン-4-オン(64.0g, 0.369mol)を1,2-ジクロロエタン(200mL)に懸濁し、塩化アルミニウム(162g, 1.21mol)を室温で少量ずつ加えた。室温で12時間攪拌した後、反応混合物を氷-水に加え、酢酸エチルで抽出した。抽出液を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下にて溶媒を留去し、淡黄色油状物を得た。油状物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(展開溶媒; 酢酸エチル-メタノール=9:1)で精製し

、エタノール-ジエチルエーテルから結晶化させることにより、8-[3-(1-アセチル-4-ピペリジニル)-1-オキソプロピル]-1,2,5,6-テトラヒドロ-4H-ピロロ[3,2,1-ij]キノリン-4-オン 123.5 g を融点 157-159℃の無色結晶として得た。

¹HNMR(CDCl₃) δ 1.00-1.30(2H, m), 1.50-1.95(5H, m), 2.09(3H, s), 2.53(1H, dt, J=12.9, 2.4 Hz), 2.72(2H, t, J=7.6 Hz), 2.90-3.15(5H, m), 3.24(2H, t, J=8.6 Hz), 3.75-3.90(1H, m), 4.14(2H, t, J=8.6 Hz), 4.55-4.70(1H, m), 7.68(1H, s), 7.73(1H, s).

2) 1) で得た8-[3-(1-アセチル-4-ピペリジニル)-1-オキソプロピル]-1,2,5,6-テトラヒドロ-4H-ピロロ[3,2,1-ij]キノリン-4-オン(118.7g, 0.335mol) に濃塩酸(600 mL) を加え、140℃ で4時間攪拌した。室温まで冷却後、減圧下に塩酸を留去し、得られた残渣を8規定水酸化ナトリウム水溶液でアルカリ性(pH>12) とし、酢酸エチルで抽出した。抽出液を飽和食塩水で洗浄、無水硫酸ナトリウムで乾燥した後、減圧下にて溶媒を留去し、酢酸エチル-ジエチルエーテルから結晶化させることにより、8-[3-(4-ピペリジニル)-1-オキソプロピル]-1,2,5,6-テトラヒドロ-4H-ピロロ[3,2,1-ij]キノリン-4-オン103.7 g を融点 114-115℃の無色結晶として得た。

¹HNMR(CDCl₃) δ 1.00-1.30(2H, m), 1.30-1.90(7H, m), 2.59(2H, dt, J=12.0, 2.4 Hz), 2.72(2H, t, J=7.6 Hz), 2.85-3.15(5H, m), 3.23(2H, t, J=8.6 Hz), 4.14(2H, t, J=8.6 Hz), 7.68(1H, s), 7.73(1H, s).

3) 2) で得た8-[3-(4-ピペリジニル)-1-オキソプロピル]-1,2,5,6-テトラヒドロ-4H-ピロロ[3,2,1-ij]キノリン-4-オン(103.7g, 0.332mol) のアセトニトリル(750mL) 溶液に、3-フルオロベンジルプロミド(65.9g, 0.349mol) 及び無水炭酸カリウム(80g) を加え、室温で12時間攪拌した。反応溶液を酢酸エチル-水混合溶液に加え、有機層を分離した。有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、濃縮して淡黄色油状物を得た。油状物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(展開溶媒: 酢酸エチル-メタノール=9:1) で精製した。得られた粗結晶を熱エタノールから再結晶して、表題化合物111.2gを融点111-112℃の無色結晶として得た。

¹HNMR(CDCl₃) δ 1.20-1.50(4H, m), 1.55-1.80(4H, m), 1.85-2.05(2H, m), 2.71(2H, t, J=7.6 Hz), 2.80-3.15(5H, m), 3.22(2H, t, J=8.6 Hz), 3.47(2H,

s), 4.13(2H, t, $J=8.6$ Hz), 6.85-7.15(3H, m), 7.20-7.35(1H, m), 7.67(1H, s), 7.72(1H, s).

元素分析値 $C_{26}H_{29}FN_2O_2$ として

計算値 : C, 74.26; H, 6.95; N, 6.66.

5 実験値 : C, 74.28; H, 7.02; N, 6.58.

上記表題化合物65.4gのエタノール溶液に1.5当量の4N塩酸(酢酸エチル溶液)を加え、溶媒と過剰の塩酸を留去して無色粉末を得た。得られた粉末をエタノールから結晶化して、表題化合物の塩酸塩64.1gを融点201-203℃(分解)の無色結晶として得た。

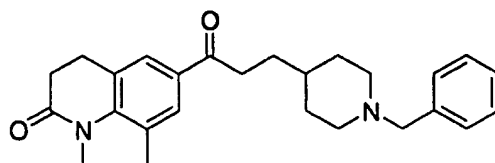
10 元素分析値 $C_{26}H_{29}FN_2O_2 \cdot HCl$ として

計算値 : C, 68.34; H, 6.62; N, 6.13.

実験値 : C, 68.15; H, 6.66; N, 6.04.

参考例15-2

8-[3-[1-(フェニルメチル)-4-ピペリジニル]-1-オキシプロピル]-1,2,5,6-
15 テトラヒドロ-4*H*-ピロロ[3,2,1-*ij*]キノリン-4-オン (参考例17の化合物)



参考例15-1の2)で得た8-[3-(4-ピペリジニル)-1-オキシプロピル]-1,2,5,6-テトラヒドロ-4*H*-ピロロ[3,2,1-*ij*]キノリン-4-オンとベンジルブロミドを用いて、参考例15-1の3)と同様の操作を行うことにより無色粉末を得た。得られた粉末をエーテル-イソプロピルエーテルから結晶化して、表
20 題化合物を融点103-104℃の無色結晶として得た。

1H NMR($CDCl_3$) δ 1.20-1.75(8H, m), 1.85-2.05(2H, m), 2.71(2H, t, $J=7.6$ Hz), 2.80-2.95(3H, m), 3.02(2H, t, $J=7.6$ Hz), 3.22(2H, t, $J=8.6$ Hz), 3.49(2H, s), 4.13(2H, t, $J=8.6$ Hz), 7.20-7.35(5H, m), 7.67(1H, s), 7.71(1H, s).

元素分析値 $C_{26}H_{30}N_2O_2$ として

25 計算値 : C, 77.58; H, 7.51; N, 6.96.

実験値 : C, 77.30; H, 7.49; N, 7.20.

上記表題化合物のエタノール溶液に1.5当量の4N塩酸（酢酸エチル溶液）を加え、溶媒と過剰の塩酸を留去して無色粉末を得た。得られた粉末をエタノールから結晶化して、表題化合物の塩酸塩を融点245-248℃（分解）の無色結晶として得た。

5 元素分析値 $C_{25}H_{30}N_2O_2 \cdot HCl$ として

計算値：C, 71.14; H, 7.12; N, 6.38.

実験値：C, 70.97; H, 7.14; N, 6.18.

製剤例1

以下、参考例15の化合物（8-[3-[1-[(3-フルオロフェニル)メチル]-4-ピペリジニル]-1-オキソプロピル]-1,2,5,6-テトラヒドロ-4H-ピロロ[3,2,1-ij]キノリン-4-オン）の塩酸塩を化合物Aと略記する。

	(1) 化合物A	1 g
	(2) 乳糖	197 g
15	(3) トウモロコシ澱粉	50 g
	(4) ステアリン酸マグネシウム	2 g

上記(1), (2)及びトウモロコシ澱粉(20g)を混和し、トウモロコシ澱粉(15g)と25mLの水から作ったペーストとともに顆粒化し、これにトウモロコシ澱粉(15g)と上記(4)を加え、混合物を圧縮錠剤機で圧縮して、錠剤1錠当たり化合物Aを0.5mg含有する直径3mmの錠剤2000個を製造した。

製剤例2

	(1) 化合物A	2 g
	(2) 乳糖	197 g
25	(3) トウモロコシ澱粉	50 g
	(4) ステアリン酸マグネシウム	2 g

製剤例1と同様の方法により、錠剤1錠当たり化合物Aを1.0mg含有する直径3mmの錠剤2000個を製造した。

製剤例3

30	(1) 化合物A	5.0 mg
----	----------	--------

(2) 乳糖	60.0 mg
(3) トウモロコシ澱粉	35.0 mg
(4) ゼラチン	3.0 mg
(5) ステアリン酸マグネシウム	2.0 mg

- 5 上記(1)、(2)及び(3)の混合物を10%ゼラチン水溶液0.03m
 1 (ゼラチンとして3.0mg)を用い、1mmメッシュの篩を通して顆粒化
 した後、40℃で乾燥した後、再び篩過した。得られた顆粒を上記(5)と混
 合し、圧縮した。得られた中心錠を蔗糖、二酸化チタン、タルク及びアラビア
 ゴムの水懸液による糖衣でコーティングした。コーティングが施された錠剤を
 10 ミツロウで艶出してコート錠を得た。

実験例 1

アセチルコリンエステラーゼ阻害活性の測定

- 参考例化合物のアセチルコリンエステラーゼ阻害活性の測定を、ヒト赤血球
 由来アセチルコリンエステラーゼを用いて、アセチルチオコリン法 (Ellm
 15 an法) にて行った。

- ヒト赤血球由来のアセチルコリンエステラーゼ (Sigma社) を蒸留水に
 て0.2 IU/mLの濃度に溶解し酵素標品とした。96wellマイクロ
 プレートに薬液20μL、80mM Tris-HCl (pH 7.4) 30
 μL、酵素標品50μL及び5mM 5,5-dithio-bis (2-n
 20 itrobenzoic acid) (Sigma社) 50μLを分注し、1
 0秒間振とうした。50μLの4mM acetylthiocholine
 iodide (Sigma社) を添加し、再度振とうした直後から10分間3
 0秒間隔で414nmにおける吸光増加を測定した。次式により酵素活性を測
 定した。

- 25
$$R = 5.74 \times 10^{-7} \times \Delta_A$$

(式中、Rは酵素活性 (mol)、 Δ_A は414nmの吸光増加を示す)

各化合物について少なくとも3回実験を繰り返し、50%阻害濃度 (IC₅₀)
) を求めた。また、上記方法と同様にして、ジスチグミンのアセチルコリンエ
 ステラーゼ阻害活性を測定した。結果を下表に示す。

- 30 [表5]

116

参考例の化合物番号 (塩)		IC ₅₀ (nM)
5	1 (塩酸塩)	13.6
	4 (塩酸塩)	10.9
	6 (塩酸塩)	18.9
	7 (塩酸塩)	22.1
	12 (塩酸塩)	8.1
10	13 (塩酸塩)	5.2
	14 (塩酸塩)	9.9
	15 (塩酸塩)	4.4
	17 (塩酸塩)	7.8
	18 (塩酸塩)	10.9
ジスチグミン		723.3

上記の結果より、化合物 (I) は優れたアセチルコリンエステラーゼ阻害作用を有することがわかる。

実験例 2

モルモット律動性膀胱収縮に対する増強作用

参考例化合物の律動性膀胱収縮に対する増強作用を、Hertley 系雄モルモットを使用して試験した。体重 300g 前後の Hertley 系雄モルモット (SLC) をウレタン (1.2g/kg, ip) 麻酔後保定し、腹部を正中切開して膀胱を露出した。尿道を結紮した後ポリエチレンチューブ (PE-50) を膀胱内に刺入した。膀胱内圧の測定は血圧アンプ (日本光電) にて行い、A/D 変換装置 (MP-30, Biopac systems) を介し、パーソナルコンピュータにデータを集積した。適当量の生理食塩水をカニユーレを通じて膀胱内に注入し、律動性の膀胱収縮を誘起した。頻度が 2 分から 10 分に 1 回の安定した律動性収縮を確認できた動物に、被検化合物を蒸留水に溶解し、静脈内投与し影響を観察した。

データ処理は、以下の方法で行った。

被検化合物投与直前の膀胱収縮と投与後 5 分以降最初の膀胱収縮の膀胱内圧曲線と基底線とで結ばれる面積 (AUC) を解析ソフト (Studentlab pro 2.1.5, Biopac systems) にて算出し、被検化合物の効果を評価した。AUC の用量依

存曲線から薬物投与前値の AUC を 2 倍に増加する用量 (AUC200) を算出し、被検化合物の膀胱筋に対する収縮増強作用強度を求めた。また、上記と同じ方法により、ジスチグミンの膀胱筋に対する収縮増強作用強度を求めた。

各化合物の AUC200 値を下表に示す。

5 〔表 6〕

参考例の化合物番号 (塩)		AUC 200 (mg/kg, i v)
	1 (塩酸塩)	0.005
	2 (塩酸塩)	0.059
	3 (塩酸塩)	0.14
10	4 (塩酸塩)	0.005
	5 (塩酸塩)	0.06
	6 (塩酸塩)	0.0049
	7 (塩酸塩)	0.0055
	8 (塩酸塩)	0.076
15	9 (塩酸塩)	0.027
	10 (塩酸塩)	0.031
	11 (塩酸塩)	0.12
	12 (塩酸塩)	0.006
	13 (塩酸塩)	0.0013
20	14 (塩酸塩)	0.0016
	15 (塩酸塩)	0.0013
	16 (塩酸塩)	0.015
	17 (塩酸塩)	0.0034
	18 (塩酸塩)	0.0051
25	19 (塩酸塩)	0.065
	20 (塩酸塩)	0.065
	21 (塩酸塩)	0.19
	22 (フマル酸塩)	0.16
	23 (フマル酸塩)	0.073
30	24 (フマル酸塩)	0.18

118

	2 5	(フマル酸塩)	0. 1 3
	2 6	(フマル酸塩)	0. 0 8 2
	2 7	(フマル酸塩)	0. 1
	2 8	(フマル酸塩)	0. 1 6
5	2 9	(塩酸塩)	0. 1 6
	ジスチグミン		0. 1

これより、化合物（I）は優れた律動性膀胱収縮に対する増強作用を有することがわかる。

10 実験例 3

モルモットにおける排尿効率に対する作用

参考例化合物のモルモットにおける排尿効率に対する作用を、Hertley 系雄モルモットを使用して試験した。体重 346.5 ± 3.5 g の Hertley 系雄モルモット（SLC）を、各処理群で 6 から 10 頭使用した。モルモットをウレタン麻酔し、
 15 保定後膀胱を露出した。膀胱内に 2 本のポリエチレンチューブ（PE-50、PE-100）を刺入し、片方（PE-50）を生理食塩水の注入に、もう一方（PE-100）を膀胱内圧の測定に用いた。生理食塩水の注入を 0.3 mL/min の流速で持続的に行い、
 間欠的な排尿を最低 3 回確認した後注入を停止し、膀胱内の生理食塩水をすべて引き抜いた。再び注入を開始し、排尿直前の膀胱内圧の上昇が確認された時
 20 点で注入を停止し、注入時間と排出される尿の重量を測定した。排尿効率は下の数式で算出した。

$$\text{排尿効率 (\%)} = 100 \times \text{排出量 (mL)} / \text{注入時間 (min)} \times 0.3 \text{ (mL/min)}$$

少なくとも 2 回の被検化合物投与前値を測定した後、被検化合物を蒸留水に溶解し、静脈内投与した。ジスチグミンは投与後 30 分の値を、参考例化合物に
 25 関しては投与後 10 分の値を測定した。それぞれ溶媒投与による効果も確認した。

被検化合物投与前の測定値を平均して投与前値とし、投与後の値と paired-t test により有意差検定を行った。（** $p < 0.01$, * $p < 0.05$ ）

排尿効率に対する作用を下表に示す。

〔表 7〕

化合物	用量 (mg/kg)	排尿効率 (%)		排尿効率改善率 (%)
		投与前	投与後	
vehicle	-	77.4±6.4	78.4±6.5	2.4
ジスチグミン	0.1	79.1±5.7	90.9±2.7	20.4
ジスチグミン	0.3	67.4±4.3	75.3±3.7	14.7
ジスチグミン	1	78.6±6.7	67.8±4.6	-11.6
ジスチグミン	3	68.6±7.0	48.1±8.5	-30.9**
vehicle	-	77.4±6.4	82.8±4.7	12.9
参考例 15 の 化合物	0.003	71.5±7.9	79.6±6.4	16.2
参考例 15 の 化合物	0.01	60.0±7.7	93.9±3.0	77.0**
参考例 15 の 化合物	0.03	65.5±9.0	88.9±3.1	66.2*
vehicle	-	78.5±6.0	73.7±8.9	-7.1
参考例 30 の 化合物	0.3	62.2±5.1	74.5±5.1	22.0**
参考例 30 の 化合物	1.0	62.8±7.8	84.9±4.8	55.4*
参考例 30 の 化合物	3.0	65.8±8.9	89.0±2.7	64.2*

** p<0.01, * p<0.05

- 上記の結果より、ジスチグミンは排尿効率改善率が小さく、かつ、高用量で
5 排尿効率を悪化させるのに対して、化合物（I）は、排尿効率改善率が大きく
、有意であり、かつ、高用量でも排尿効率を悪化させないことがわかる。

実験例 4

モルモットにおける尿流率に対する作用

- 参考例化合物、ジスチグミン、プラゾシン、タムスロシンの単独及び併用による尿流率に対する作用を、Hertley 系雄性モルモットを使用して試験した。体重 350g 前後の Hertley 系雄性モルモット (Slc) を、各処理群で 4 匹から 6 匹使用した。モルモットをウレタン麻酔し、保定後膀胱を露出した。膀胱内に
- 5 2 本のポリエチレンチューブ (PE-100) を刺入し、片方を生理食塩水の注入に、もう一方を膀胱内圧の測定に用いた。生理食塩水の注入を 0.3 mL/min の流速で持続的に行い、間欠的な排尿を最低 3 回確認した後注入を停止し、膀胱内の生理食塩水をすべて引き抜いた。再び注入を開始し、排尿直前の膀胱内圧の上昇が確認された時点で注入を停止した。排出される尿の重量を電子天秤 (HX-
- 10 400, A&D) で測定した。膀胱内圧及び尿重量のアナログデータを AD 変換器 (MP-30, Biopac Systems) に入力し、デジタル信号を専用のソフトウェア (Student lab pro 2.1.5, Biopac Systems) にて解析した。データのサンプリング間隔は 0.1 秒とし、尿重量の値を微分して尿流率を求めた。排出量及び尿流率のデータのノイズを除去するため 0.5Hz で lowcut filter をかけた。
- 15 2 回の被検化合物投与前値を測定した後、被検化合物を静脈内投与した。被検化合物投与の 10 分後に再度測定を行った。コントロール実験として、溶媒投与による効果も確認した。
- 被検化合物投与前の測定値を平均して投与前値とし、投与前値に対する投与後の変化の割合を算出して、Dunnet 検定により群間比較を行った。
- 20 尿流率に対する作用を下表にまとめた。

〔表 8〕

	用量 (mg/kg)	n	尿流率 (mL/sec)		改善率 (%)
			投与前	投与後	
DMSO (コントロール)	—	5	0.34±0.05	0.30±0.05	-13.85±6.48
プラゾシン	0.1	5	0.18±0.03	0.17±0.02	0.97±10.32
ジスチグミン	1.0	6	0.25±0.05	0.22±0.05	-8.31±11.13
ジスチグミン + プラゾシン	1.0 0.1	4	0.30±0.07	0.25±0.09	-24.17±12.31
参考例 15 の 化合物	0.01	5	0.27±0.03	0.29±0.05	6.81±7.84
参考例 15 の 化合物 + プラゾシン	0.01 0.1	5	0.18±0.01	0.25±0.03	42.37±15.25**

** p<0.01 vs DMSO(コントロール)

5 〔表 9〕

	用量 (mg/kg)	n	尿流率 (mL/sec)		改善率 (%)
			投与前	投与後	
蒸留水 (コントロール)	—	11	0.16±0.01	0.12±0.01	-22.0±6.5
タムスロシン	0.1	11	0.16±0.01	0.14±0.02	-11.8±4.8
参考例 15 の 化合物	0.001	9	0.17±0.03	0.15±0.02	-6.5±12.1
参考例 15 の 化合物 + タムスロシン	0.001 0.1	10	0.15±0.01	0.16±0.01	11.3±9.2*

* p<0.05 vs 蒸留水 (コントロール)

上記の結果より、ジスチグミンは単独での尿流率改善率が小さく、かつ、 α -遮断薬であるプラゾシンとの併用により改善率は向上しないことがわかる。一方、化合物 (I) は、単独でも尿流率を改善すると共に、 α -遮断薬である

プラゾシン又はタムスロシンとの併用により尿流率を大きく改善させることがわかる。

上記実験例 2、3 及び 4 の結果から、アセチルコリンエステラーゼ阻害作用を有する非カルバメート系アミン化合物、特に化合物 (I) は優れた膀胱排出
5 力改善作用を有することがわかる。

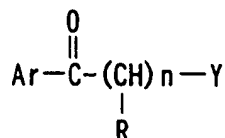
産業上の利用性

本発明で用いられるアミン化合物は、優れた膀胱筋収縮増強作用を有すると共に、尿道筋収縮作用を有しないことから、排尿効率が高く、膀胱排出力改善
10 剤として有用である。更には、排尿障害、特に排尿困難の予防及び治療剤としても有用である。

請求の範囲

1. アセチルコリンエステラーゼ阻害作用を有する非カルバメート系アミン化合物を含有してなる膀胱排出力改善剤。

2. アミン化合物が、式



〔式中、Arは縮合していてもよいフェニル基で、該フェニル基は置換基を有していてもよい、

nは1ないし10の整数、

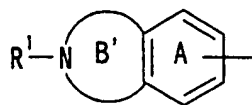
Rは水素原子又は置換基を有していてもよい炭化水素基、

Yは置換基を有していてもよいアミノ基又は置換基を有していてもよい含窒素飽和複素環基を示す。〕で表される非カルバメート系化合物又はその塩である請求項1記載の剤。

3. Arがフェニル基であり、(i) ハロゲン化されていてもよい低級アルキル基、(ii) ハロゲン原子、(iii) 低級アルキレンジオキシ基、(iv) ニトロ基、(v) シアノ基、(vi) ヒドロキシ基、(vii) ハロゲン化されていてもよい低級アルコキシ基、(viii) シクロアルキル基、(ix) ハロゲン化されていてもよい低級アルキルチオ基、(x) アミノ基、(xi) モノー低級アルキルアミノ基、(xii) ジー低級アルキルアミノ基、(xiii) 5ないし7員環状アミノ基、(xiv) 低級アルキル-カルボニルアミノ基、(xv) 低級アルキルスルホニルアミノ基、(xvi) 低級アルコキシ-カルボニル基、(xvii) カルボキシ基、(xviii) 低級アルキル-カルボニル基、(xix) シクロアルキル-カルボニル基、(xx) カルバモイル基、チオカルバモイル基、(xxi) モノー低級アルキル-カルバモイル基、(xxii) ジー低級アルキル-カルバモイル基、(xxiii) 低級アルキルスルホニル基、(xxiv) シクロアルキルスルホニル基、(xxv) フェニル基、(xxvi) ナフチル基、(xxvii) モノーフェニル-低級アルキル基、(xxviii) ジーフェニル-低級アルキル基、(xxix) モノーフェニル-低級アルキル-カルボニルオキシ基、(xxx) ジーフェニル-低級アルキル-カルボニルオキシ基、(xxxi) フェノキシ基、(xxxii) モノーフェニル-低級アルキル-カルボ

ニル基、(xxxiii) ジーフェニルー低級アルキルーカルボニル基、(xxxiv) ベンゾイル基、(xxxv) フェノキシカルボニル基、(xxxvi) フェニルー低級アルキルーカルバモイル基、(xxxvii) フェニルカルバモイル基、(xxxviii) フェニルー低級アルキルーカルボニルアミノ基、(xxxix) フェニルー低級アルキルアミノ基、(xxxx) フェニルー低級アルキルスルホニル基、(xxxxi) フェニルスルホニル基、(xxxxii) フェニルー低級アルキルスルフィニル基、(xxxxiii) フェニルー低級アルキルスルホニルアミノ基及び (xxxxiv) フェニルスルホニルアミノ基（前記 (xxv) ないし (xxxxiv) のフェニル基、ナフチル基、モノーフェニルー低級アルキル基、ジーフェニルー低級アルキル基、モノーフェニルー低級アルキルーカルボニルオキシ基、ジーフェニルー低級アルキルーカルボニルオキシ基、フェノキシ基、モノーフェニルー低級アルキルーカルボニル基、ジーフェニルー低級アルキルーカルボニル基、ベンゾイル基、フェノキシカルボニル基、フェニルー低級アルキルーカルバモイル基、フェニルカルバモイル基、フェニルー低級アルキルーカルボニルアミノ基、フェニルー低級アルキルアミノ基、フェニルー低級アルキルスルホニル基、フェニルスルホニル基、フェニルー低級アルキルスルフィニル基、フェニルー低級アルキルスルホニルアミノ基及びフェニルスルホニルアミノ基は、更に、低級アルキル基、低級アルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ベンジルオキシ基、アミノ基、モノー低級アルキルアミノ基、ジー低級アルキルアミノ基、ニトロ基、低級アルキルーカルボニル基及びベンゾイル基から選ばれる置換基を1ないし4個有していてもよい。）から選ばれる置換基を1ないし4個有していてもよい請求項2記載の剤。

4. Ar が式



〔式中、R¹は水素原子、置換基を有していてもよい炭化水素基、アシル基又は置換基を有していてもよい複素環基、A環は置換基を有していてもよいベンゼン環、B'環は更にオキソ基で置換されていてもよい5ないし9員の含窒素複素環を示す。〕で表される基である請求項2記載の剤。

5. R¹が(1)水素原子、
- (2) (i) ハロゲン原子、(ii) ニトロ基、(iii) シアノ基、(iv) オキソ基、(v) ヒドロキシ基、(vi) ハロゲン化されていてもよい低級アルキル基、(vii) ハロゲン化されていてもよい低級アルコキシ基、(viii) ハロゲン化されていてもよい低級アルキルチオ基、(ix) アミノ基、(x) モノー低級アルキルアミノ基、(xi) ジー低級アルキルアミノ基、(xii) 炭素原子と1個の窒素原子以外に窒素原子、酸素原子及び硫黄原子から選ばれるヘテロ原子を1ないし3個有していてもよい5ないし7員環状アミノ基、(xiii) 低級アルキルカルボニルアミノ基、(xiv) 低級アルキルスルホニルアミノ基、(xv) 低級アルコキシカルボニル基、(xvi) カルボキシ基、(xvii) 低級アルキルカルボニル基、(xviii) カルバモイル基、チオカルバモイル基、(xix) モノー低級アルキルカルバモイル基、(xx) ジー低級アルキルカルバモイル基、(xxi) 低級アルキルスルホニル基、(xxii) 低級アルコキシカルボニル低級アルキル基、(xxiii) カルボキシ低級アルキル基、(xxiv) (1)ハロゲン原子、(2)ニトロ基、(3)シアノ基、(4)オキソ基、(5)ヒドロキシ基、(6)低級アルキル基、(7)低級アルコキシ基、(8)低級アルキルチオ基、(9)アミノ基、(10)モノー低級アルキルアミノ基、(11)ジー低級アルキルアミノ基、(12)炭素原子と1個の窒素原子以外に窒素原子、酸素原子及び硫黄原子から選ばれるヘテロ原子を1ないし3個有していてもよい5ないし7員環状アミノ基、(13)低級アルキルカルボニルアミノ基、(14)低級アルキルスルホニルアミノ基、(15)低級アルコキシカルボニル基、(16)カルボキシ基、(17)低級アルキルカルボニル基、(18)カルバモイル基、チオカルバモイル基、(19)モノー低級アルキルカルバモイル基、(20)ジー低級アルキルカルバモイル基及び(21)低級アルキルスルホニル基から選ばれる置換基を1ないし5個有していてもよい窒素原子、酸素原子及び硫黄原子から選ばれるヘテロ原子を1ないし6個含む5ないし14員複素環基、(xxv) C₆₋₁₄アリール基、(xxvi) C₇₋₁₆アラルキル基、(xxvii) ウレイド基、3-メチルウレイド基、3-エチルウレイド基、3-フェニルウレイド基、3-(4-フルオロフェニル)ウレイド基、3-(2-メチルフェニル)ウレイド基、3-(4-メトキシフェニル)ウレイド基、3-(2,4-ジフルオロフェニル)ウレイド基、3-[3,5-ビス(トリフ

ルオロメチル) フェニル] ウレイド基、3-ベンジルウレイド基、3-(1-
ナフチル) ウレイド基又は3-(2-ビフェニリル) ウレイド基、(xxviii)
チオウレイド基、3-メチルチオウレイド基、3-エチルチオウレイド基、3-
フェニルチオウレイド基、3-(4-フルオロフェニル) チオウレイド基、
5 3-(4-メチルフェニル) チオウレイド基、3-(4-メトキシフェニル)
チオウレイド基、3-(2, 4-ジクロロフェニル) チオウレイド基、3-ベン
ジルチオウレイド基又は3-(1-ナフチル) チオウレイド基、(xxix) ア
ミジノ基、 N^1 -メチルアミジノ基、 N^1 -エチルアミジノ基、 N^1 -フェニル
アミジノ基、 N^1 , N^1 -ジメチルアミジノ基、 N^1 , N^2 -ジメチルアミジノ基
10 、 N^1 -メチル- N^1 -エチルアミジノ基、 N^1 , N^1 -ジエチルアミジノ基、 N^1 -
メチル- N^1 -フェニルアミジノ基又は N^1 , N^1 -ジ(4-ニトロフェニル)
アミジノ基、(xxx) グアニジノ基、3-メチルグアニジノ基、3, 3-ジメ
チルグアニジノ基又は3, 3-ジエチルグアニジノ基、(xxxi) ピロリジノカ
ルボニル基、ピペリジノカルボニル基、(4-メチルピペリジノ)カルボニル基
15 、(4-フェニルピペリジノ)カルボニル基、(4-ベンジルピペリジノ)カ
ルボニル基、(4-ベンゾイルピペリジノ)カルボニル基、[4-(4-フル
オロベンゾイル)ピペリジノ]カルボニル基、(4-メチルピペラジノ)カル
ボニル基、(4-フェニルピペラジノ)カルボニル基、[4-(4-ニトロフ
ェニル)ピペラジノ]カルボニル基、(4-ベンジルピペラジノ)カルボニル
20 基、モルホリノカルボニル基又はチオモルホリノカルボニル基、(xxxii) アミ
ノチオカルボニル基、メチルアミノチオカルボニル基又はジメチルアミノチオ
カルボニル基、(xxxiii) アミノスルホニル基、メチルアミノスルホニル基又
はジメチルアミノスルホニル基、(xxxiv) フェニルスルホニルアミノ基、(4-
メチルフェニル)スルホニルアミノ基、(4-クロロフェニル)スルホニル
25 アミノ基、(2, 5-ジクロロフェニル)スルホニルアミノ基、(4-メトキ
シフェニル)スルホニルアミノ基、(4-アセチルアミノフェニル)スルホニ
ルアミノ基又は(4-ニトロフェニル)フェニルスルホニルアミノ基、(xxxv
)スルホ基、(xxxvi) スルフィノ基、(xxxvii) スルフェノ基、(xxxviii)
低級アルキルスルホ基、(xxxix) 低級アルキルスルフィノ基、(xxxx) 低級ア
30 ルキルスルフェノ基、(xxxxi) ホスホノ基及び(xxxxii) ジー低級アルコキシ

ホスホリル基から選ばれる置換基を1ないし5個有していてもよいアルキル基、アルケニル基、アルキニル基、シクロアルキル基、架橋環式低級飽和炭化水素基、アリール基、アラルキル基、アリールーアルケニル基、アリールーC₂-₁₂アルキニル基、シクロアルキルーアルキル基又はアリールーアリールーC₁-₁₀アルキル基、

- (3) 式 $-(C=O)-R^2$ 、 $-(C=O)-OR^2$ 、 $-(C=O)-NR^2R^3$ 、 $-SO_2-R^2$ 、 $-SO-R^2$ 、 $-(C=S)-OR^2$ 又は $-(C=S)NR^2R^3$ で表されるアシル基 (R^2 及び R^3 がそれぞれ①水素原子又は② (i) ハロゲン原子、(ii) ニトロ基、(iii) シアノ基、(iv) オキソ基、(v) ヒドロキシ基、(vi) ハロゲン化されていてもよい低級アルキル基、(vii) ハロゲン化されていてもよい低級アルコキシ基、(viii) ハロゲン化されていてもよい低級アルキルチオ基、(ix) アミノ基、(x) モノー低級アルキルアミノ基、(xi) ジー低級アルキルアミノ基、(xii) 炭素原子と1個の窒素原子以外に窒素原子、酸素原子及び硫黄原子から選ばれるヘテロ原子を1ないし3個有していてもよい5ないし7員環状アミノ基、(xiii) 低級アルキルーカルボニルアミノ基、(xiv) 低級アルキルスルホニルアミノ基、(xv) 低級アルコキシカルボニル基、(xvi) カルボキシ基、(xvii) 低級アルキルーカルボニル基、(xviii) カルバモイル基、チオカルバモイル基、(xix) モノー低級アルキルーカルバモイル基、(xx) ジー低級アルキルーカルバモイル基、(xxi) 低級アルキルスルホニル基、(xxii) 低級アルコキシカルボニルー低級アルキル基、(xxiii) カルボキシ低級アルキル基、(xxiv) (1)ハロゲン原子、(2)ニトロ基、(3)シアノ基、(4)オキソ基、(5)ヒドロキシ基、(6)低級アルキル基、(7)低級アルコキシ基、(8)低級アルキルチオ基、(9)アミノ基、(10)モノー低級アルキルアミノ基、(11)ジ低級アルキルアミノ基、(12)炭素原子と1個の窒素原子以外に窒素原子、酸素原子及び硫黄原子から選ばれるヘテロ原子を1ないし3個有していてもよい5ないし7員環状アミノ基、(13)低級アルキルーカルボニルアミノ基、(14)低級アルキルスルホニルアミノ基、(15)低級アルコキシカルボニル基、(16)カルボキシ基、(17)低級アルキルーカルボニル基、(18)カルバモイル基、チオカルバモイル基、(19)モノー低級アルキルーカルバモイル基、(20)ジ低級アルキルーカルバモイル基及び(21)低級アルキルスルホニル基から選ば

れる置換基を1ないし5個有していてもよい、窒素原子、酸素原子及び硫黄原子から選ばれるヘテロ原子を1ないし6個含む5ないし14員複素環基、(xxv) C_{6-14} アリール基、(xxvi) C_{7-16} アラルキル基、(xxvii) ウレイド基、3-メチルウレイド基、3-エチルウレイド基、3-フェニルウレイド基、3-
5 (4-フルオロフェニル) ウレイド基、3-(2-メチルフェニル) ウレイド基、3-(4-メトキシフェニル) ウレイド基、3-(2, 4-ジフルオロフェニル) ウレイド基、3-[3, 5-ビス(トリフルオロメチル) フェニル] ウレイド基、3-ベンジルウレイド基、3-(1-ナフチル) ウレイド基又は3-(2-ピフェニリル) ウレイド基、(xxviii) チオウレイド基、3-メチルチオウレイド基、3-エチルチオウレイド基、3-フェニルチオウレイド
10 基、3-(4-フルオロフェニル) チオウレイド基、3-(4-メチルフェニル) チオウレイド基、3-(4-メトキシフェニル) チオウレイド基、3-(2, 4-ジクロロフェニル) チオウレイド基、3-ベンジルチオウレイド基又は3-(1-ナフチル) チオウレイド基、(xxix) アミジノ基、 N^1 -メチルアミジノ基、 N^1 -エチルアミジノ基、 N^1 -フェニルアミジノ基、 N^1 , N^1 -ジメチルアミジノ基、 N^1 , N^2 -ジメチルアミジノ基、 N^1 -メチル- N^1 -エチルアミジノ基、 N^1 , N^1 -ジエチルアミジノ基、 N^1 -メチル- N^1 -フェニルアミジノ基又は N^1 , N^1 -ジ(4-ニトロフェニル) アミジノ基、(xxx)
15) グアニジノ基、3-メチルグアニジノ基、3, 3-ジメチルグアニジノ基又は3, 3-ジエチルグアニジノ基、(xxxi) ピロリジノカルボニル基、ピペリジノカルボニル基、(4-メチルピペリジノ)カルボニル基、(4-フェニルピペリジノ)カルボニル基、(4-ベンジルピペリジノ)カルボニル基、(4-ベンゾイルピペリジノ)カルボニル基、[4-(4-フルオロベンゾイル)ピペリジノ]カルボニル基、(4-メチルピペラジノ)カルボニル基、(4-フェニルピペラジノ)カルボニル基、[4-(4-ニトロフェニル)ピペラジノ]
20]カルボニル基、(4-ベンジルピペラジノ)カルボニル基、モルホリノカルボニル基又はチオモルホリノカルボニル基、(xxxii) アミノチオカルボニル基、メチルアミノチオカルボニル基又はジメチルアミノチオカルボニル基、(xxxiii) アミノスルホニル基、メチルアミノスルホニル基又はジメチルアミノ
25 スルホニル基、(xxxiv) フェニルスルホニルアミノ基、(4-メチルフェニル

- 5) スルホニルアミノ基、(4-クロロフェニル)スルホニルアミノ基、(2,5-ジクロロフェニル)スルホニルアミノ基、(4-メトキシフェニル)スルホニルアミノ基、(4-アセチルアミノフェニル)スルホニルアミノ基又は(4-ニトロフェニル)フェニルスルホニルアミノ基、(xxxv)スルホ基、(xxxvi)
- 10) スルフィノ基、(xxxvii)スルフェノ基、(xxxviii)低級アルキルスルホ基、(xxxix)低級アルキルスルフィノ基、(xxxx)低級アルキルスルフェノ基、(xxxxi)ホスホノ基及び(xxxxii)ジ-低級アルコキシホスホリル基から選ばれる置換基を1ないし5個有していてもよいアルキル基、アルケニル基、アルキニル基、シクロアルキル基、架橋環式低級飽和炭化水素基、アリール基、アラ
- 15 ルキル基、アリール-アルケニル基、アリール-C₂₋₁₂アルキニル基、シクロアルキル-アルキル基又はアリール-アリール-C₁₋₁₀アルキル基である)、又は
- (4)(1)ハロゲン原子、(2)ニトロ基、(3)シアノ基、(4)オキソ基、(5)ヒドロキシ基、(6)低級アルキル基、(7)低級アルコキシ基、(8)低級アルキルチオ基、
- 20 (9)アミノ基、(10)モノ-低級アルキルアミノ基、(11)ジ-低級アルキルアミノ基、(12)炭素原子と1個の窒素原子以外に窒素原子、酸素原子及び硫黄原子から選ばれるヘテロ原子を1ないし3個有していてもよい5ないし7員環状アミノ基、(13)低級アルキル-カルボニルアミノ基、(14)低級アルキルスルホニルアミノ基、(15)低級アルコキシ-カルボニル基、(16)カルボキシ基、(17)低級
- 25 アルキル-カルボニル基、(18)カルバモイル基、チオカルバモイル基、(19)モノ-低級アルキル-カルバモイル基、(20)ジ-低級アルキル-カルバモイル基及び(21)低級アルキルスルホニル基から選ばれる置換基を1ないし5個有していてもよい、窒素原子、酸素原子及び硫黄原子から選ばれるヘテロ原子1ないし6個を含む5ないし14員複素環基、
- 30 A環が(i)ハロゲン化されていてもよい低級アルキル基、(ii)ハロゲン原子、(iii)低級アルキレンジオキシ基、(iv)ニトロ基、(v)シアノ基、(vi)ヒドロキシ基、(vii)ハロゲン化されていてもよい低級アルコキシ基、(viii)シクロアルキル基、(ix)ハロゲン化されていてもよい低級アルキルチオ基、(x)アミノ基、(xi)モノ-低級アルキルアミノ基、(xii)ジ-低級アルキルアミノ基、(xiii)5ないし7員環状アミノ基、(xiv)低級アルキル

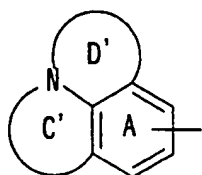
ーカルボニルアミノ基、(xv) 低級アルキルスルホニルアミノ基、(xvi) 低級アルコキシカルボニル基、(xvii) カルボキシ基、(xviii) 低級アルキルカルボニル基、(xix) シクロアルキルカルボニル基、(xx) カルバモイル基、チオカルバモイル基、(xxi) モノ低級アルキルカルバモイル基、(xxii) 5 ジー低級アルキルカルバモイル基、(xxiii) 低級アルキルスルホニル基、(xxiv) シクロアルキルスルホニル基、(xxv) フェニル基、(xxvi) ナフチル基、(xxvii) モノフェニル低級アルキル基、(xxviii) ジーフェニル低級アルキル基、(xxix) モノフェニル低級アルキルカルボニルオキシ基、(xxx) ジーフェニル低級アルキルカルボニルオキシ基、(xxxi) フェノキシ基、(xxxii) モノフェニル低級アルキルカルボニル基、(xxxiii) 10 ジーフェニル低級アルキルカルボニル基、(xxxiv) ベンゾイル基、(xxxv) フェノキシカルボニル基、(xxxvi) フェニル低級アルキルカルバモイル基、(xxxvii) フェニルカルバモイル基、(xxxviii) フェニル低級アルキルカルボニルアミノ基、(xxxix) フェニル低級アルキルアミノ、(xxxx) フェニル低級アルキルスルホニル基、(xxxxi) フェニルスルホニル基、(xxxxii) 15 フェニル低級アルキルスルフィニル基、(xxxxiii) フェニル低級アルキルスルホニルアミノ基及び (xxxxiv) フェニルスルホニルアミノ基 (前記 (xxv) ないし (xxxxiv) に記載のフェニル基、ナフチル基、モノフェニル低級アルキル基、20 ジーフェニル低級アルキル基、モノフェニル低級アルキルカルボニルオキシ基、フェノキシ基、モノフェニル低級アルキルカルボニル基、フェニル低級アルキルカルボニル基、ベンゾイル基、フェノキシカルボニル基、フェニル低級アルキルカルバモイル基、フェニルカルバモイル基、フェニル低級アルキルカルボニルアミノ基、フェニル低級アルキルアミノ、フェニル低級アルキルスルホニル基、フェニルスルホニル基、フェニル低級アルキルスルフィニル基、フェニル低級アルキルスルホニルアミノ基及びフェニルスルホニルアミノ基は、更に、低級アルキル基、低級アルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ベンジルオキシ基、アミノ基、モノ低級アルキルアミノ基、25 ジー低級アルキルアミノ基、ニトロ基、低級アルキルカルボニル基及びベンゾイル基から選ばれる置換基を 1 ないし 4 個有していてもよい。)

から選ばれる置換基を1ないし3個有していてもよいベンゼン環、及び

B'環が更にオキシ基で置換されていてもよい炭素原子及び1個の窒素原子
 以外に、窒素原子、酸素原子及び硫黄原子から選ばれるヘテロ原子を1ないし
 3個含有していてもよい5ないし9員の含窒素複素環である請求項4記載の剤

5

6. Arが式



〔式中、A環は置換基を有していてもよいベンゼン環、C'環及びD'環は、そ
 れぞれ更にオキシ基で置換されていてもよい5ないし9員の含窒素複素環を示
 す。〕で表される基である請求項2記載の剤。

10

7. A環が (i) ハロゲン化されていてもよい低級アルキル基、(ii) ハロゲン
 原子、(iii) 低級アルキレンジオキシ基、(iv) ニトロ基、(v) シアノ基、
 (vi) ヒドロキシ基、(vii) ハロゲン化されていてもよい低級アルコキシ基、
 (viii) シクロアルキル基、(ix) ハロゲン化されていてもよい低級アルキル
 チオ基、(x) アミノ基、(xi) モノ低級アルキルアミノ基、(xii) ジー低
 級アルキルアミノ基、(xiii) 5ないし7員環状アミノ基、(xiv) 低級アルキ
 ルーカルボニルアミノ基、(xv) 低級アルキルスルホニルアミノ基、(xvi) 低
 級アルコキシカルボニル基、(xvii) カルボキシ基、(xviii) 低級アルキル
 ーカルボニル基、(xix) シクロアルキルーカルボニル基、(xx) カルバモイル
 基、チオカルバモイル基、(xxi) モノ低級アルキルーカルバモイル基、(xxii)
) ジー低級アルキルーカルバモイル基、(xxiii) 低級アルキルスルホニル基、
 (xxiv) シクロアルキルスルホニル基、(xxv) フェニル基、(xxvi) ナフチル
 基、(xxvii) モノフェニルー低級アルキル基、(xxviii) ジーフェニルー低
 級アルキル基、(xxix) モノフェニルー低級アルキルーカルボニルオキシ基
 、(xxx) ジーフェニルー低級アルキルーカルボニルオキシ基、(xxxi) フェノ
 キシ基、(xxxii) モノフェニルー低級アルキルーカルボニル基、(xxxiii)
) ジーフェニルー低級アルキルーカルボニル基、(xxxiv) ベンゾイル基、(xxxv

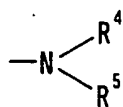
25

-) フェノキシカルボニル基、(xxxvi) フェニル-低級アルキル-カルバモイル
 基、(xxxvii) フェニルカルバモイル基、(xxxviii) フェニル-低級アルキル
 -カルボニルアミノ基、(xxxix) フェニル-低級アルキルアミノ、(xxxx) フェ
 ニル-低級アルキルスルホニル基、(xxxxi) フェニルスルホニル基、(xxxxii)
 5) フェニル-低級アルキルスルフィニル基、(xxxxiii) フェニル-低級アルキ
 ルスルホニルアミノ基及び (xxxxiv) フェニルスルホニルアミノ基 (前記 (xxv
) ないし (xxxxiv) に記載のフェニル基、ナフチル基、モノ-フェニル-低級
 アルキル基、ジ-フェニル-低級アルキル基、モノ-フェニル-低級アルキル
 -カルボニルオキシ基、ジ-フェニル-低級アルキル-カルボニルオキシ基、
 10 フェノキシ基、モノ-フェニル-低級アルキル-カルボニル基、ジ-フェニル
 -低級アルキル-カルボニル基、ベンゾイル基、フェノキシカルボニル基、フェ
 ニル-低級アルキル-カルバモイル基、フェニルカルバモイル基、フェニル
 -低級アルキル-カルボニルアミノ基、フェニル-低級アルキルアミノ、フェ
 ニル-低級アルキルスルホニル基、フェニルスルホニル基、フェニル-低級ア
 15 ルキルスルフィニル基、フェニル-低級アルキルスルホニルアミノ基及びフェ
 ニルスルホニルアミノ基は、更に、低級アルキル基、低級アルコキシ基、ハロ
 ゲン原子、ヒドロキシ基、ベンジルオキシ基、アミノ基、モノ-低級アルキル
 アミノ基、ジ-低級アルキルアミノ基、ニトロ基、低級アルキル-カルボニル
 基及びベンゾイル基から選ばれる置換基を 1 ないし 4 個有していてもよい。)
- 20 から選ばれる置換基を 1 ないし 2 個有していてもよいベンゼン環、及び
 C' 環及び D' 環が更にオキソ基で置換されていてもよい炭素原子及び 1 個の
 窒素原子以外に、窒素原子、酸素原子及び硫黄原子から選ばれるヘテロ原子を
 1 ないし 3 個含有していてもよい 5 ないし 9 員の含窒素複素環である請求項 6
 記載の剤。
- 25 8. n が 2 である請求項 2 記載の剤。
 9. R が (1) 水素原子又は (2) (i) ハロゲン原子、(ii) ニトロ基、(iii)
) シアノ基、(iv) オキソ基、(v) ヒドロキシ基、(vi) ハロゲン化されてい
 てもよい低級アルキル基、(vii) ハロゲン化されていてもよい低級アルコキシ
 基、(viii) ハロゲン化されていてもよい低級アルキルチオ基、(ix) アミノ
 30 基、(x) モノ-低級アルキルアミノ基、(xi) ジ-低級アルキルアミノ基、(

- xii) 炭素原子と1個の窒素原子以外に窒素原子、酸素原子及び硫黄原子から選ばれるヘテロ原子を1ないし3個有していてもよい5ないし7員環状アミノ基、(xiii) 低級アルキル-カルボニルアミノ基、(xiv) 低級アルキルスルホニルアミノ基、(xv) 低級アルコキシ-カルボニル基、(xvi) カルボキシ基、(xvii) 低級アルキル-カルボニル基、(xviii) カルバモイル基、チオカルバモイル基、(xix) モノ-低級アルキル-カルバモイル基、(xx) ジ-低級アルキル-カルバモイル基、(xxi) 低級アルキルスルホニル基、(xxii) 低級アルコキシ-カルボニル-低級アルキル基、(xxiii) カルボキシ-低級アルキル基、(xxiv) (1)ハロゲン原子、(2)ニトロ基、(3)シアノ基、(4)オキソ基、(5)ヒドロキシ基、(6)低級アルキル基、(7)低級アルコキシ基、(8)低級アルキルチオ基、(9)アミノ基、(10)モノ-低級アルキルアミノ基、(11)ジ-低級アルキルアミノ基、(12)炭素原子と1個の窒素原子以外に窒素原子、酸素原子及び硫黄原子から選ばれるヘテロ原子を1ないし3個有していてもよい5ないし7員環状アミノ基、(13)低級アルキル-カルボニルアミノ基、(14)低級アルキルスルホニルアミノ基、(15)低級アルコキシ-カルボニル基、(16)カルボキシ基、(17)低級アルキル-カルボニル基、(18)カルバモイル基、チオカルバモイル基、(19)モノ-低級アルキル-カルバモイル基、(20)ジ-低級アルキル-カルバモイル基及び(21)低級アルキルスルホニル基から選ばれる置換基を1ないし5個有していてもよい、窒素原子、酸素原子及び硫黄原子から選ばれるヘテロ原子を1ないし6個含む5ないし14員複素環基、(xxv) C_{6-14} アリール基、(xxvi) C_{7-16} アラルキル基、(xxvii) ウレイド基、3-メチルウレイド基、3-エチルウレイド基、3-フェニルウレイド基、3-(4-フルオロフェニル)ウレイド基、3-(2-メチルフェニル)ウレイド基、3-(4-メトキシフェニル)ウレイド基、3-(2,4-ジフルオロフェニル)ウレイド基、3-[3,5-ビス(トリフルオロメチル)フェニル]ウレイド基、3-ベンジルウレイド基、3-(1-ナフチル)ウレイド基又は3-(2-ビフェニリル)ウレイド基、(xxviii) チオウレイド基、3-メチルチオウレイド基、3-エチルチオウレイド基、3-フェニルチオウレイド基、3-(4-フルオロフェニル)チオウレイド基、3-(4-メチルフェニル)チオウレイド基、3-(4-メトキシフェニル)チオウレイド基、3-(2,4-ジクロロフェニル)

- チオウレイド基、3-ベンジルチオウレイド基又は3-(1-ナフチル)チオウレイド基、(xxix)アミノ基、 N^1 -メチルアミノ基、 N^1 -エチルアミノ基、 N^1 -フェニルアミノ基、 N^1 、 N^1 -ジメチルアミノ基、 N^1 、 N^2 -ジメチルアミノ基、 N^1 -メチル- N^1 -エチルアミノ基、 N^1 、 N^1 -ジエチルアミノ基、 N^1 -メチル- N^1 -フェニルアミノ基、 N^1 、 N^1 -ジ(4-ニトロフェニル)アミノ基、(xxx)グアニジノ基、3-メチルグアニジノ基、3, 3-ジメチルグアニジノ基又は3, 3-ジエチルグアニジノ基、(xxxi)ピロリジノカルボニル基、ピペリジノカルボニル基、(4-メチルピペリジノ)カルボニル基、(4-フェニルピペリジノ)カルボニル基、(4-ベンジルピペリジノ)カルボニル基、(4-ベンゾイルピペリジノ)カルボニル基、[4-(4-フルオロベンゾイル)ピペリジノ]カルボニル基、(4-メチルピペラジノ)カルボニル基、(4-フェニルピペラジノ)カルボニル基、[4-(4-ニトロフェニル)ピペラジノ]カルボニル基、(4-ベンジルピペラジノ)カルボニル基、モルホリノカルボニル基又はチオモルホリノカルボニル基、(xxxii)アミノチオカルボニル基、メチルアミノチオカルボニル基又はジメチルアミノチオカルボニル基、(xxxiii)アミノスルホニル基、メチルアミノスルホニル基又はジメチルアミノスルホニル基、(xxxiv)フェニルスルホニルアミノ基、(4-メチルフェニル)スルホニルアミノ基、(4-クロロフェニル)スルホニルアミノ基、(2, 5-ジクロロフェニル)スルホニルアミノ基、(4-メトキシフェニル)スルホニルアミノ基、(4-アセチルアミノフェニル)スルホニルアミノ基又は(4-ニトロフェニル)フェニルスルホニルアミノ基、(xxxv)スルホ基、(xxxvi)スルフィノ基、(xxxvii)スルフェノ基、(xxxviii)低級アルキルスルホ基、(xxxix)低級アルキルスルフィノ基、(xxxx)低級アルキルスルフェノ基、(xxxxi)ホスホノ基及び(xxxxii)ジ-低級アルコキシホスホリル基から選ばれる置換基を1ないし5個有していてもよいアルキル基、アルケニル基、アルキニル基、シクロアルキル基、架橋環式低級飽和炭化水素基、アリール基、アラルキル基、アリール-アルケニル基、アリール- C_{2-12} アルキニル基、シクロアルキル-アルキル基又はアリール-アリール- C_{1-10} アルキル基である請求項2記載の剤。
10. Rが水素原子である請求項2記載の剤。

11. Yが(A)式



で表される基 (R⁴及びR⁵がそれぞれ (1) 水素原子、

- (2) (i) ハロゲン原子、(ii) ニトロ基、(iii) シアノ基、(iv) オキシ
 5 基、(v) ヒドロキシ基、(vi) ハロゲン化されていてもよい低級アルキル基、
 (vii) ハロゲン化されていてもよい低級アルコキシ基、(viii) ハロゲン化さ
 れていてもよい低級アルキルチオ基、(ix) アミノ基、(x) モノー低級アルキ
 ルアミノ基、(xi) ジー低級アルキルアミノ基、(xii) 炭素原子と1個の窒素
 原子以外に窒素原子、酸素原子及び硫黄原子から選ばれるヘテロ原子を1ない
 10 し3個有していてもよい5ないし7員環状アミノ基、(xiii) 低級アルキル
 ーカルボニルアミノ基、(xiv) 低級アルキルスルホニルアミノ基、(xv) 低級
 アルコキシカルボニル基、(xvi) カルボキシ基、(xvii) 低級アルキル
 ーカルボニル基、(xviii) カルバモイル基、チオカルバモイル基、(xix) モ
 ノー低級アルキル
 ーカルバモイル基、(xx) ジー低級アルキル
 ーカルバモイル基、
 15 (xxi) 低級アルキルスルホニル基、(xxii) 低級アルコキシカルボニル
 ー低級アルキル基、(xxiii) カルボキシ
 ー低級アルキル基、(xxiv) (1) ハロゲン
 原子、(2) ニトロ基、(3) シアノ基、(4) オキシ基、(5) ヒドロキシ基、(6) 低級
 アルキル基、(7) 低級アルコキシ基、(8) 低級アルキルチオ基、(9) アミノ
 基、(10) モノー低級アルキルアミノ基、(11) ジー低級アルキルアミノ基、
 20 (12) 炭素原子と1個の窒素原子以外に窒素原子、酸素原子及び硫黄原子
 から選ばれるヘテロ原子を1ないし3個有していてもよい5ないし7員環状
 アミノ基、(13) 低級アルキル
 ーカルボニルアミノ基、(14) 低級アルキルスルホニルアミノ基、(15) 低
 級アルコキシカルボニル基、(16) カルボキシ基、(17) 低級アルキル
 ーカルボニル基、(18) カルバモイル基、チオカルバモイル基、(19) モ
 ノー低級アルキル
 ーカルバモイル基、(20) ジー低級アルキル
 ーカルバモイル基及び(21) 低級アル
 25 キルスルホニル基から選ばれる置換基を1ないし5個有していてもよい、
 窒素原子、酸素原子及び硫黄原子から選ばれるヘテロ原子を1ないし6
 個含む5ないし14員複素環基、(xxv) C₆₋₁₄アリール基、(xxvi) C₇₋₁₆アラ
 ルキル

- 基、(xxvii) ウレイド基、3-メチルウレイド基、3-エチルウレイド基、3-フェニルウレイド基、3-(4-フルオロフェニル)ウレイド基、3-(2-メチルフェニル)ウレイド基、3-(4-メトキシフェニル)ウレイド基、3-(2, 4-ジフルオロフェニル)ウレイド基、3-[3, 5-ビス(トリフルオロメチル)フェニル]ウレイド基、3-ベンジルウレイド基、3-(1-ナフチル)ウレイド基又は3-(2-ビフェニリル)ウレイド基、(xxviii) チオウレイド基、3-メチルチオウレイド基、3-エチルチオウレイド基、3-フェニルチオウレイド基、3-(4-フルオロフェニル)チオウレイド基、3-(4-メチルフェニル)チオウレイド基、3-(4-メトキシフェニル)チオウレイド基、3-(2, 4-ジクロロフェニル)チオウレイド基、3-ベンジルチオウレイド基又は3-(1-ナフチル)チオウレイド基、(xxix) アミノ基、 N^1 -メチルアミノ基、 N^1 -エチルアミノ基、 N^1 -フェニルアミノ基、 N^1 , N^1 -ジメチルアミノ基、 N^1 , N^2 -ジメチルアミノ基、 N^1 -メチル- N^1 -エチルアミノ基、 N^1 , N^1 -ジエチルアミノ基、 N^1 -メチル- N^1 -フェニルアミノ基又は N^1 , N^1 -ジ(4-ニトロフェニル)アミノ基、(xxx) グアニジノ基、3-メチルグアニジノ基、3, 3-ジメチルグアニジノ基又は3, 3-ジエチルグアニジノ基、(xxxi) ピロリジノカルボニル基、ピペリジノカルボニル基、(4-メチルピペリジノ)カルボニル基、(4-フェニルピペリジノ)カルボニル基、(4-ベンジルピペリジノ)カルボニル基、(4-ベンゾイルピペリジノ)カルボニル基、[4-(4-フルオロベンゾイル)ピペリジノ]カルボニル基、(4-メチルピペラジノ)カルボニル基、(4-フェニルピペラジノ)カルボニル基、[4-(4-ニトロフェニル)ピペラジノ]カルボニル基、(4-ベンジルピペラジノ)カルボニル基、モルホリノカルボニル基又はチオモルホリノカルボニル基、(xxxii) アミノチオカルボニル基、メチルアミノチオカルボニル基又はジメチルアミノチオカルボニル基、(xxxiii) アミノスルホニル基、メチルアミノスルホニル基又はジメチルアミノスルホニル基、(xxxiv) フェニルスルホニルアミノ基、(4-メチルフェニル)スルホニルアミノ基、(4-クロロフェニル)スルホニルアミノ基、(2, 5-ジクロロフェニル)スルホニルアミノ基、(4-メトキシフェニル)スルホニルアミノ基、(4-アセチルアミノフェニル)スルホ

- ニルアミノ基又は(4-ニトロフェニル)フェニルスルホニルアミノ基、(xxxv)
)スルホ基、(xxxvi)スルフィノ基、(xxxvii)スルフェノ基、(xxxviii)
 低級アルキルスルホ基、(xxxix)低級アルキルスルフィノ基、(xxxx)低級ア
 ルキルスルフェノ基、(xxxxi)ホスホノ基及び(xxxxii)ジ-低級アルコキシ
 5 ホスホリル基から選ばれる置換基を1ないし5個有していてもよいアルキル基
 、アルケニル基、アルキニル基、シクロアルキル基、架橋環式低級飽和炭化水
 素基、アリール基、アラルキル基、アリール-アルケニル基、アリール- C_{2-12}
 C_{1-10} アルキニル基、シクロアルキル-アルキル基又はアリール-アリール- C_{1-10}
 アルキル基、又は
- 10 (3)式 $-(C=O)-R^2$ 、 $-(C=O)-OR^2$ 、 $-(C=O)-NR^2R^3$ 、 $-SO_2-R^2$ 、 $-SO-R^2$ 、 $-(C=S)-OR^2$ 又は $-(C=S)NR^2R^3$ で表
 されるアシル基(R^2 及び R^3 がそれぞれ①水素原子、②(i)ハロゲン原子、
 (ii)ニトロ基、(iii)シアノ基、(iv)オキソ基、(v)ヒドロキシ基、(vi)
 ハロゲン化されていてもよい低級アルキル基、(vii)ハロゲン化されてい
 てもよい低級アルコキシ基、(viii)ハロゲン化されていてもよい低級アルキ
 15 ルチオ基、(ix)アミノ基、(x)モノ-低級アルキルアミノ基、(xi)ジ-低
 級アルキルアミノ基、(xii)炭素原子と1個の窒素原子以外に窒素原子、酸素
 原子及び硫黄原子から選ばれるヘテロ原子を1ないし3個有していてもよい5
 ないし7員環状アミノ基、(xiii)低級アルキル-カルボニルアミノ基、(xiv)
 20)低級アルキルスルホニルアミノ基、(xv)低級アルコキシ-カルボニル基、
 (xvi)カルボキシ基、(xvii)低級アルキル-カルボニル基、(xviii)カル
 バモイル基、チオカルバモイル基、(xix)モノ-低級アルキル-カルバモイル
 基、(xx)ジ-低級アルキル-カルバモイル基、(xxi)低級アルキルスルホニ
 ル基、(xxii)低級アルコキシ-カルボニル-低級アルキル基、(xxiii)カル
 25 ボキシ-低級アルキル基、(xxiv)(1)ハロゲン原子、(2)ニトロ基、(3)シアノ
 基、(4)オキソ基、(5)ヒドロキシ基、(6)低級アルキル基、(7)低級アルコキシ
 基、(8)低級アルキルチオ基、(9)アミノ基、(10)モノ-低級アルキルアミノ基
 、(11)ジ-低級アルキルアミノ基、(12)炭素原子と1個の窒素原子以外に窒素
 原子、酸素原子及び硫黄原子から選ばれるヘテロ原子を1ないし3個有してい
 30 てもよい5ないし7員環状アミノ基、(13)低級アルキル-カルボニルアミノ基

- 、(14)低級アルキルスルホニルアミノ基、(15)低級アルコキシカルボニル基、(16)カルボキシ基、(17)低級アルキルカルボニル基、(18)カルバモイル基、チオカルバモイル基、(19)モノ低級アルキルカルバモイル基、(20)ジ低級アルキルカルバモイル基及び(21)低級アルキルスルホニル基から選ばれる置換基を1ないし5個有していてもよい窒素原子、酸素原子及び硫黄原子から選ばれるヘテロ原子を1ないし6個含む5ないし14員複素環基、(xxv) C_{6-14} アリール基、(xxvi) C_{7-16} アラルキル基、(xxvii) ウレイド基、3-メチルウレイド基、3-エチルウレイド基、3-フェニルウレイド基、3-(4-フルオロフェニル)ウレイド基、3-(2-メチルフェニル)ウレイド基、3-(4-メトキシフェニル)ウレイド基、3-(2,4-ジフルオロフェニル)ウレイド基、3-[3,5-ビス(トリフルオロメチル)フェニル]ウレイド基、3-ベンジルウレイド基、3-(1-ナフチル)ウレイド基又は3-(2-ピフェニル)ウレイド基、(xxviii) チオウレイド基、3-メチルチオウレイド基、3-エチルチオウレイド基、3-フェニルチオウレイド基、3-(4-フルオロフェニル)チオウレイド基、3-(4-メチルフェニル)チオウレイド基、3-(4-メトキシフェニル)チオウレイド基、3-(2,4-ジクロロフェニル)チオウレイド基、3-ベンジルチオウレイド基又は3-(1-ナフチル)チオウレイド基、(xxix) アミノ基、 N^1 -メチルアミノ基、 N^1 -エチルアミノ基、 N^1 -フェニルアミノ基、 N^1 , N^1 -ジメチルアミノ基、 N^1 , N^2 -ジメチルアミノ基、 N^1 -メチル- N^1 -エチルアミノ基、 N^1 , N^1 -ジエチルアミノ基、 N^1 -メチル- N^1 -フェニルアミノ基又は N^1 , N^1 -ジ(4-ニトロフェニル)アミノ基、(xxx) グアニジノ基、3-メチルグアニジノ基、3,3-ジメチルグアニジノ基又は3,3-ジエチルグアニジノ基、(xxxi) ピロリジノカルボニル基、ピペリジノカルボニル基、(4-メチルピペリジノ)カルボニル基、(4-フェニルピペリジノ)カルボニル基、(4-ベンジルピペリジノ)カルボニル基、(4-ベンゾイルピペリジノ)カルボニル基、[4-(4-フルオロベンゾイル)ピペリジノ]カルボニル基、(4-メチルピペラジノ)カルボニル基、(4-フェニルピペラジノ)カルボニル基、[4-(4-ニトロフェニル)ピペラジノ]カルボニル基、(4-ベンジルピペラジノ)カルボニル基、モルホリノカルボニル

- 基又はチオモルホリノカルボニル基、(xxxii) アミノチオカルボニル基、メチルアミノチオカルボニル基又はジメチルアミノチオカルボニル基、(xxxiii) アミノスルホニル基、メチルアミノスルホニル基又はジメチルアミノスルホニル基、(xxxiv) フェニルスルホニルアミノ基、(4-メチルフェニル) スルホニルアミノ基、(4-クロロフェニル) スルホニルアミノ基、(2, 5-ジクロロフェニル) スルホニルアミノ基、(4-メトキシフェニル) スルホニルアミノ基、(4-アセチルアミノフェニル) スルホニルアミノ基又は(4-ニトロフェニル) フェニルスルホニルアミノ基、(xxxv) スルホ基、(xxxvi) スルフィノ基、(xxxvii) スルフェノ基、(xxxviii) 低級アルキルスルホ基、(xxxix) 低級アルキルスルフィノ基、(xxxx) 低級アルキルスルフェノ基、(xxxxi) ホスホノ基及び(xxxxii) ジー低級アルコキシホスホリル基から選ばれる置換基を1ないし5個有していてもよいアルキル基、アルケニル基、アルキニル基、シクロアルキル基、架橋環式低級飽和炭化水素基、アリール基、アラルキル基、アリール-アルケニル基、アリール- C_{2-12} アルキニル基、シクロアルキル-アルキル基又はアリール-アリール- C_{1-10} アルキル基、③(1)ハロゲン原子、(2)ニトロ基、(3)シアノ基、(4)オキソ基、(5)ヒドロキシ基、(6)低級アルキル基、(7)低級アルコキシ基、(8)低級アルキルチオ基、(9)アミノ基、(10)モノ-低級アルキルアミノ基、(11)ジー低級アルキルアミノ基、(12)炭素原子と1個の窒素原子以外に窒素原子、酸素原子及び硫黄原子から選ばれるヘテロ原子を1ないし3個有していてもよい5ないし7員環状アミノ基、(13)低級アルキル-カルボニルアミノ基、(14)低級アルキルスルホニルアミノ基、(15)低級アルコキシ-カルボニル基、(16)カルボキシ基、(17)低級アルキル-カルボニル基、(18)カルバモイル基、チオカルバモイル基、(19)モノ-低級アルキル-カルバモイル基、(20)ジー低級アルキル-カルバモイル基及び(21)低級アルキルスルホニル基から選ばれる置換基を1ないし5個有していてもよい窒素原子、酸素原子及び硫黄原子から選ばれるヘテロ原子を1ないし6個含む5ないし14員複素環基、又は④ R^2 と R^3 とは互いに結合して隣接する窒素原子と共に形成する炭素原子及び1個の窒素原子以外に、窒素原子、酸素原子及び硫黄原子から選ばれるヘテロ原子を1ないし3個含有していてもよい5ないし9員の含窒素飽和複素環基 ((1)ハロゲン原子、(2)ニトロ基、(3)シアノ基、(4)オ

キソ基、(5)ヒドロキシ基、(6)低級アルキル基、(7)低級アルコキシ基、(8)低級アルキルチオ基、(9)アミノ基、(10)モノー低級アルキルアミノ基、(11)ジー低級アルキルアミノ基、(12)炭素原子と1個の窒素原子以外に窒素原子、酸素原子及び硫黄原子から選ばれるヘテロ原子を1ないし3個有していてもよい5
5 ないし7員環状アミノ基、(13)低級アルキルカルボニルアミノ基、(14)低級アルキルスルホニルアミノ基、(15)低級アルコキシカルボニル基、(16)カルボキシ基、(17)低級アルキルカルボニル基、(18)カルバモイル基、チオカルバモイル基、(19)モノー低級アルキルカルバモイル基、(20)ジー低級アルキルカルバモイル基及び(21)低級アルキルスルホニル基から選ばれる置換基を
10 1ないし5個有していてもよい)を形成していてもよい)、又は

(B) (1)ハロゲン原子、(2)ニトロ基、(3)シアノ基、(4)オキシ基、(5)ヒドロキシ基、(6)低級アルキル基、(7)低級アルコキシ基、(8)低級アルキルチオ基、(9)アミノ基、(10)モノー低級アルキルアミノ基、(11)ジー低級アルキルアミノ基、(12)炭素原子と1個の窒素原子以外に窒素原子、酸素原子及び硫黄原子から選ばれるヘテロ原子を1ないし3個有していてもよい5ないし7員環状アミノ基、(13)低級アルキルカルボニルアミノ基、(14)低級アルキルスルホニルアミノ基、(15)低級アルコキシカルボニル基、(16)カルボキシ基、(17)低級アルキルカルボニル基、(18)カルバモイル基、チオカルバモイル基、(19)モノー低級アルキルカルバモイル基、(20)ジー低級アルキルカルバモイル基及び(21)低級アルキルスルホニル基から選ばれる置換基を1ないし5個有していてもよく、

含窒素飽和複素環中の窒素原子は(1) (i)ハロゲン原子、(ii)ニトロ基、(iii)シアノ基、(iv)オキシ基、(v)ヒドロキシ基、(vi)ハロゲン化されていてもよい低級アルキル基、(vii)ハロゲン化されていてもよい低級アルコキシ基、(viii)ハロゲン化されていてもよい低級アルキルチオ基、(ix)アミノ基、(x)モノー低級アルキルアミノ基、(xi)ジー低級アルキルアミノ基、(xii)炭素原子と1個の窒素原子以外に窒素原子、酸素原子及び硫黄原子から選ばれるヘテロ原子を1ないし3個有していてもよい5ないし7員環状アミノ基、(xiii)低級アルキルカルボニルアミノ基、(xiv)低級アルキルスルホニルアミノ基、(xv)低級アルコキシカルボニル基、(xvi)カルボキ

- シ基、(xvii) 低級アルキル-カルボニル基、(xviii) カルバモイル基、チオカルバモイル基、(xix) モノ-低級アルキル-カルバモイル基、(xx) ジ-低級アルキル-カルバモイル基、(xxi) 低級アルキルスルホニル基、(xxii) 低級アルコキシ-カルボニル-低級アルキル基、(xxiii) カルボキシ-低級アルキル基、(xxiv) (1)ハロゲン原子、(2)ニトロ基、(3)シアノ基、(4)オキソ基、(5)ヒドロキシ基、(6)低級アルキル基、(7)低級アルコキシ基、(8)低級アルキルチオ基、(9)アミノ基、(10)モノ-低級アルキルアミノ基、(11)ジ-低級アルキルアミノ基、(12)炭素原子と1個の窒素原子以外に窒素原子、酸素原子及び硫黄原子から選ばれるヘテロ原子を1ないし3個有していてもよい5ないし7員環状アミノ基、(13)低級アルキル-カルボニルアミノ基、(14)低級アルキルスルホニルアミノ基、(15)低級アルコキシ-カルボニル基、(16)カルボキシ基、(17)低級アルキル-カルボニル基、(18)カルバモイル基、チオカルバモイル基、(19)モノ-低級アルキル-カルバモイル基、(20)ジ-低級アルキル-カルバモイル基及び(21)低級アルキルスルホニル基から選ばれる置換基を1ないし5個有していてもよい窒素原子、酸素原子及び硫黄原子から選ばれるヘテロ原子を1ないし6個含む5ないし14員複素環基、(xxv) C_{6-14} アリール基、(xxvi) C_{7-16} アラルキル基、(xxvii) ウレイド基、3-メチルウレイド基、3-エチルウレイド基、3-フェニルウレイド基、3-(4-フルオロフェニル)ウレイド基、3-(2-メチルフェニル)ウレイド基、3-(4-メトキシフェニル)ウレイド基、3-(2,4-ジフルオロフェニル)ウレイド基、3-[3,5-ビス(トリフルオロメチル)フェニル]ウレイド基、3-ベンジルウレイド基、3-(1-ナフチル)ウレイド基又は3-(2-ピフェニル)ウレイド基、(xxviii) チオウレイド基、3-メチルチオウレイド基、3-エチルチオウレイド基、3-フェニルチオウレイド基、3-(4-フルオロフェニル)チオウレイド基、3-(4-メチルフェニル)チオウレイド基、3-(4-メトキシフェニル)チオウレイド基、3-(2,4-ジクロロフェニル)チオウレイド基、3-ベンジルチオウレイド基又は3-(1-ナフチル)チオウレイド基、(xxix) アミジノ基、 N^1 -メチルアミジノ基、 N^1 -エチルアミジノ基、 N^1 -フェニルアミジノ基、 N^1 、 N^1 -ジメチルアミジノ基、 N^1 、 N^2 -ジメチルアミジノ基、 N^1 -メチル- N^1 -エチルアミジノ基、 N

- ¹, N¹-ジエチルアミノ基、N¹-メチル-N¹-フェニルアミノ基又はN¹, N¹-ジ(4-ニトロフェニル)アミノ基、(xxx) グアニジノ基、3-メチルグアニジノ基、3, 3-ジメチルグアニジノ基又は3, 3-ジエチルグアニジノ基、(xxxi) ピロリジノカルボニル基、ピペリジノカルボニル基、(4-メチルピペリジノ)カルボニル基、(4-フェニルピペリジノ)カルボニル基、(4-ベンジルピペリジノ)カルボニル基、(4-ベンゾイルピペリジノ)カルボニル基、[4-(4-フルオロベンゾイル)ピペリジノ]カルボニル基、(4-メチルピペラジノ)カルボニル基、(4-フェニルピペラジノ)カルボニル基、[4-(4-ニトロフェニル)ピペラジノ]カルボニル基、(4-ベンジルピペラジノ)カルボニル基、モルホリノカルボニル基又はチオモルホリノカルボニル基、(xxxii) アミノチオカルボニル基、メチルアミノチオカルボニル基又はジメチルアミノチオカルボニル基、(xxxiii) アミノスルホニル基、メチルアミノスルホニル基又はジメチルアミノスルホニル基、(xxxiv) フェニルスルホニルアミノ基、(4-メチルフェニル)スルホニルアミノ基、(4-クロロフェニル)スルホニルアミノ基、(2, 5-ジクロロフェニル)スルホニルアミノ基、(4-メトキシフェニル)スルホニルアミノ基、(4-アセチルアミノフェニル)スルホニルアミノ基又は(4-ニトロフェニル)フェニルスルホニルアミノ基、(xxxv) スルホ基、(xxxvi) スルフィノ基、(xxxvii) スルフェノ基、(xxxviii) 低級アルキルスルホ基、(xxxix) 低級アルキルスルフィノ基、(xxxx) 低級アルキルスルフェノ基、(xxxxi) ホスホノ基及び(xxxxii) ジ-低級アルコキシホスホリル基から選ばれる置換基を1ないし5個有していてもよいアルキル基、アルケニル基、アルキニル基、シクロアルキル基、架橋環式低級飽和炭化水素基、アリール基、アラルキル基、アリール-アルケニル基、アリール-C₂₋₁₂アルキニル基、シクロアルキル-アルキル基又はアリール-アリール-C₁₋₁₀アルキル基、
- (2) 式-(C=O)-R²、-(C=O)-OR²、-(C=O)-NR²R³、-SO₂-R²、-SO-R²、-(C=S)-OR² 又は -(C=S)NR²R³で表されるアシル基 (R²及びR³がそれぞれ①水素原子又は② (i) ハロゲン原子、(ii) ニトロ基、(iii) シアノ基、(iv) オキソ基、(v) ヒドロキシ基、(vi) ハロゲン化されていてもよい低級アルキル基、(vii) ハロゲン化されて

いてもよい低級アルコキシ基、(viii) ハロゲン化されていてもよい低級アルキルチオ基、(ix) アミノ基、(x) モノー低級アルキルアミノ基、(xi) ジー低級アルキルアミノ基、(xii) 炭素原子と1個の窒素原子以外に窒素原子、酸素原子及び硫黄原子から選ばれるヘテロ原子を1ないし3個有していてもよい

5 5ないし7員環状アミノ基、(xiii) 低級アルキルカルボニルアミノ基、(xiv) 低級アルキルスルホニルアミノ基、(xv) 低級アルコキシカルボニル基、(xvi) カルボキシ基、(xvii) 低級アルキルカルボニル基、(xviii) カルバモイル基、チオカルバモイル基、(xix) モノー低級アルキルカルバモイル基、(xx) ジー低級アルキルカルバモイル基、(xxi) 低級アルキルスルホニル基、(xxii) 低級アルコキシカルボニル低級アルキル基、(xxiii) カ

10 ルボキシ低級アルキル基、(xxiv) (1)ハロゲン原子、(2)ニトロ基、(3)シアノ基、(4)オキソ基、(5)ヒドロキシ基、(6)低級アルキル基、(7)低級アルコキシ基、(8)低級アルキルチオ基、(9)アミノ基、(10)モノー低級アルキルアミノ基、(11)ジ低級アルキルアミノ基、(12)炭素原子と1個の窒素原子以外に窒

15 素原子、酸素原子及び硫黄原子から選ばれるヘテロ原子を1ないし3個有していてもよい5ないし7員環状アミノ基、(13)低級アルキルカルボニルアミノ基、(14)低級アルキルスルホニルアミノ基、(15)低級アルコキシカルボニル基、(16)カルボキシ基、(17)低級アルキルカルボニル基、(18)カルバモイル基、チオカルバモイル基、(19)モノー低級アルキルカルバモイル基、(20)ジ

20 ー低級アルキルカルバモイル基及び(21)低級アルキルスルホニル基から選ばれる置換基を1ないし5個有していてもよい、窒素原子、酸素原子及び硫黄原子から選ばれるヘテロ原子を1ないし6個含む5ないし14員複素環基、(xxv)

(xxv) C_{6-14} アリール基、(xxvi) C_{7-16} アラルキル基、(xxvii) ウレイド基、3-メチルウレイド基、3-エチルウレイド基、3-フェニルウレイド基、3-

25 -(4-フルオロフェニル)ウレイド基、3-(2-メチルフェニル)ウレイド基、3-(4-メトキシフェニル)ウレイド基、3-(2,4-ジフルオロフェニル)ウレイド基、3-[3,5-ビス(トリフルオロメチル)フェニル]ウレイド基、3-ベンジルウレイド基、3-(1-ナフチル)ウレイド基又は3-(2-ピフェニル)ウレイド基、(xxviii) チオウレイド基、3-メ

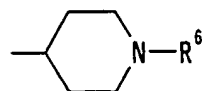
30 チルチオウレイド基、3-エチルチオウレイド基、3-フェニルチオウレイド

基、3-(4-フルオロフェニル)チオウレイド基、3-(4-メチルフェニル)チオウレイド基、3-(4-メトキシフェニル)チオウレイド基、3-(2,4-ジクロロフェニル)チオウレイド基、3-ベンジルチオウレイド基又は3-(1-ナフチル)チオウレイド基、(xxix)アミノ基、 N^1 -メチルアミノ基、 N^1 -エチルアミノ基、 N^1 -フェニルアミノ基、 N^1 , N^1 -ジメチルアミノ基、 N^1 , N^2 -ジメチルアミノ基、 N^1 -メチル- N^1 -エチルアミノ基、 N^1 , N^1 -ジエチルアミノ基、 N^1 -メチル- N^1 -フェニルアミノ基又は N^1 , N^1 -ジ(4-ニトロフェニル)アミノ基、(xxx)グアニジノ基、3-メチルグアニジノ基、3,3-ジメチルグアニジノ基又は3,3-ジエチルグアニジノ基、(xxxi)ピロリジノカルボニル基、ピペリジノカルボニル基、(4-メチルピペリジノ)カルボニル基、(4-フェニルピペリジノ)カルボニル基、(4-ベンジルピペリジノ)カルボニル基、(4-ベンゾイルピペリジノ)カルボニル基、[4-(4-フルオロベンゾイル)ピペリジノ]カルボニル基、(4-メチルピペラジノ)カルボニル基、(4-フェニルピペラジノ)カルボニル基、[4-(4-ニトロフェニル)ピペラジノ]カルボニル基、(4-ベンジルピペラジノ)カルボニル基、モルホリノカルボニル基又はチオモルホリノカルボニル基、(xxxii)アミノチオカルボニル基、メチルアミノチオカルボニル基又はジメチルアミノチオカルボニル基、(xxxiii)アミノスルホニル基、メチルアミノスルホニル基又はジメチルアミノスルホニル基、(xxxiv)フェニルスルホニルアミノ基、(4-メチルフェニル)スルホニルアミノ基、(4-クロロフェニル)スルホニルアミノ基、(2,5-ジクロロフェニル)スルホニルアミノ基、(4-メトキシフェニル)スルホニルアミノ基、(4-アセチルアミノフェニル)スルホニルアミノ基又は(4-ニトロフェニル)フェニルスルホニルアミノ基、(xxxv)スルホ基、(xxxvi)スルフィノ基、(xxxvii)スルフェノ基、(xxxviii)低級アルキルスルホ基、(xxxix)低級アルキルスルフィノ基、(xxxx)低級アルキルスルフェノ基、(xxxxi)ホスホノ基及び(xxxxii)ジ-低級アルコキシホスホリル基から選ばれる置換基を1ないし5個有していてもよいアルキル基、アルケニル基、アルキニル基、シクロアルキル基、架橋環式低級飽和炭化水素基、アリール基、アラール基、アリール-アルケニル基、アリール- C_{2-12} アルキニル基、シク

ロアルキル-アルキル基又はアリール-アリール- C_{1-10} アルキル基である)、又は

- (3) (1)ハロゲン原子、(2)ニトロ基、(3)シアノ基、(4)オキソ基、(5)ヒドロキシ基、(6)低級アルキル基、(7)低級アルコキシ基、(8)低級アルキルチオ基、
 5 (9)アミノ基、(10)モノ-低級アルキルアミノ基、(11)ジ-低級アルキルアミノ基、(12)炭素原子と1個の窒素原子以外に窒素原子、酸素原子及び硫黄原子から選ばれるヘテロ原子を1ないし3個有していてもよい5ないし7員環状アミノ基、(13)低級アルキル-カルボニルアミノ基、(14)低級アルキルスルホニルアミノ基、(15)低級アルコキシ-カルボニル基、(16)カルボキシ基、(17)低級
 10 アルキル-カルボニル基、(18)カルバモイル基、チオカルバモイル基、(19)モノ-低級アルキル-カルバモイル基、(20)ジ-低級アルキル-カルバモイル基及び(21)低級アルキルスルホニル基から選ばれる置換基を1ないし5個有していてもよい窒素原子、酸素原子及び硫黄原子から選ばれるヘテロ原子を1ないし6個含む5ないし14員複素環で置換されていてもよい、
 15 炭素原子及び1個の窒素原子以外に、窒素原子、酸素原子及び硫黄原子から選ばれるヘテロ原子を1ないし3個含有していてもよい5ないし9員含窒素飽和複素環基である請求項2記載の剤。

12. Yが式



- 20 [式中、 R^6 は水素原子、置換基を有していてもよい炭化水素基、アシル基又は置換基を有していてもよい複素環基を示す。]で表される基である請求項2記載の剤。

13. R^6 が(1)水素原子又は(2) (i)ハロゲン原子、(ii)ニトロ基、(iii)シアノ基、(iv)オキソ基、(v)ヒドロキシ基、(vi)ハロゲン化されていてもよい低級アルキル基、(vii)ハロゲン化されていてもよい低級アルコキシ基、(viii)ハロゲン化されていてもよい低級アルキルチオ基、(ix)アミノ基、(x)モノ-低級アルキルアミノ基、(xi)ジ-低級アルキルアミノ基、(xii)炭素原子と1個の窒素原子以外に窒素原子、酸素原子及び硫黄原子から選ばれるヘテロ原子を1ないし3個有していてもよい5ないし7員環状
- 25

- アミノ基、(xiii) 低級アルキル-カルボニルアミノ基、(xiv) 低級アルキル
 スルホニルアミノ基、(xv) 低級アルコキシ-カルボニル基、(xvi) カルボキ
 シ基、(xvii) 低級アルキル-カルボニル基、(xviii) カルバモイル基、チオ
 カルバモイル基、(xix) モノ-低級アルキル-カルバモイル基、(xx) ジー-低
 5 級アルキル-カルバモイル基、(xxi) 低級アルキルスルホニル基、(xxii) 低
 級アルコキシ-カルボニル-低級アルキル基、(xxiii) カルボキシ-低級アル
 キル基、(xxiv) (1)ハロゲン原子、(2)ニトロ基、(3)シアノ基、(4)オキソ基
 、(5)ヒドロキシ基、(6)低級アルキル基、(7)低級アルコキシ基、(8)低級アル
 キルチオ基、(9)アミノ基、(10)モノ-低級アルキルアミノ基、(11)ジー-低級ア
 10 ルキルアミノ基、(12)炭素原子と1個の窒素原子以外に窒素原子、酸素原子及
 び硫黄原子から選ばれるヘテロ原子を1ないし3個有していてもよい5ないし
 7員環状アミノ基、(13)低級アルキル-カルボニルアミノ基、(14)低級アルキ
 ルスルホニルアミノ基、(15)低級アルコキシ-カルボニル基、(16)カルボキシ
 基、(17)低級アルキル-カルボニル基、(18)カルバモイル基、(19)モノ-低級
 15 アルキル-カルバモイル基、(20)ジー-低級アルキル-カルバモイル基及び(21)
 低級アルキルスルホニル基から選ばれる置換基を1ないし5個有していてもよ
 い窒素原子、酸素原子及び硫黄原子から選ばれるヘテロ原子を1ないし6個含
 む5ないし14員複素環から水素原子を1個除去してできる基、(xxv) C_{6-11}
 アリール基、(xxvi) C_{7-16} アラルキル基、(xxvii) ウレイド基、3-メチ
 20 ルウレイド基、3-エチルウレイド基、3-フェニルウレイド基、3-(4-
 フルオロフェニル)ウレイド基、3-(2-メチルフェニル)ウレイド基、3-
 (4-メトキシフェニル)ウレイド基、3-(2,4-ジフルオロフェニル)
)ウレイド基、3-[3,5-ビス(トリフルオロメチル)フェニル]ウレイ
 ド基、3-ベンジルウレイド基、3-(1-ナフチル)ウレイド基又は3-(
 25 2-ピフェニリル)ウレイド基、(xxviii) チオウレイド基、3-メチルチオ
 ウレイド基、3-エチルチオウレイド基、3-フェニルチオウレイド基、3-
 (4-フルオロフェニル)チオウレイド基、3-(4-メチルフェニル)チオ
 ウレイド基、3-(4-メトキシフェニル)チオウレイド基、3-(2,4-
 ジクロロフェニル)チオウレイド基、3-ベンジルチオウレイド基又は3-(
 30 1-ナフチル)チオウレイド基、(xxix) アミジノ基、 N^1 -メチルアミジノ

- 基、 N^1 -エチルアミノ基、 N^1 -フェニルアミノ基、 N^1 、 N^1 -ジメチルアミノ基、 N^1 、 N^2 -ジメチルアミノ基、 N^1 -メチル- N^1 -エチルアミノ基、 N^1 、 N^1 -ジエチルアミノ基、 N^1 -メチル- N^1 -フェニルアミノ基又は N^1 、 N^1 -ジ(4-ニトロフェニル)アミノ基、(xxx) グアニジノ基、3-メチルグアニジノ基、3, 3-ジメチルグアニジノ基又は3, 3-ジエチルグアニジノ基、(xxxi) ピロリジノカルボニル基、ピペリジノカルボニル基、(4-メチルピペリジノ)カルボニル基、(4-フェニルピペリジノ)カルボニル基、(4-ベンジルピペリジノ)カルボニル基、(4-ベンゾイルピペリジノ)カルボニル基、[4-(4-フルオロベンゾイル)ピペリジノ]カルボニル基、(4-メチルピペラジノ)カルボニル基、(4-フェニルピペラジノ)カルボニル基、[4-(4-ニトロフェニル)ピペラジノ]カルボニル基、(4-ベンジルピペラジノ)カルボニル基、モルホリノカルボニル基又はチオモルホリノカルボニル基、(xxxii) アミノチオカルボニル基、メチルアミノチオカルボニル基又はジメチルアミノチオカルボニル基、(xxxiii) アミノスルホニル基、メチルアミノスルホニル基、ジメチルアミノスルホニル基、(xxxiv) フェニルスルホニルアミノ基、(4-メチルフェニル)スルホニルアミノ基、(4-クロロフェニル)スルホニルアミノ基、(2, 5-ジクロロフェニル)スルホニルアミノ基、(4-メトキシフェニル)スルホニルアミノ基、(4-アセチルアミノフェニル)スルホニルアミノ基又は(4-ニトロフェニル)フェニルスルホニルアミノ基、(xxxv) スルホ基、(xxxvi) スルフィノ基、(xxxvii) スルフェノ基、(xxxviii) 低級アルキルスルホ基、(xxxix) 低級アルキルスルフィノ基、(xxxx) 低級アルキルスルフェノ基、(xxxxi) ホスホノ基及び(xxxxii) ジ-低級アルコキシホスホリル基から選ばれる置換基を1ないし5個有していてもよいアルキル基、アルケニル基、アルキニル基、シクロアルキル基、架橋環式低級飽和炭化水素基、アリール基、アラルキル基、アリール-アルケニル基、アリール- C_{2-12} アルキニル基、シクロアルキル-アルキル基又はアリール-アリール- C_{1-10} アルキル基、(3) 式-(C=O)- R^2 、-(C=O)-OR 2 、-(C=O)-NR 2 R 3 、-SO $_2$ - R^2 、-SO- R^2 、-(C=S)-OR 2 又は -(C=S)NR 2 R 3 で表されるアシル基(R^2 及び R^3 がそれぞれ①水素原子、②(i) ハロゲン原子、(ii) ニトロ基

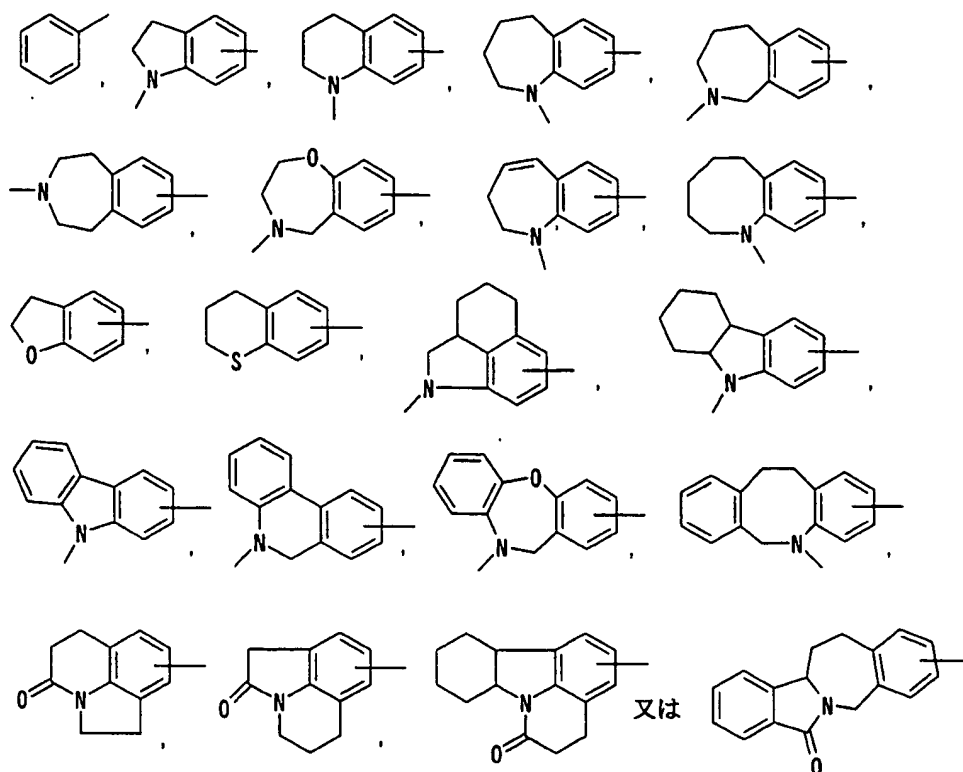
、(iii) シアノ基、(iv) オキソ基、(v) ヒドロキシ基、(vi) ハロゲン化
されていてもよい低級アルキル基、(vii) ハロゲン化されていてもよい低級ア
ルコキシ基、(viii) ハロゲン化されていてもよい低級アルキルチオ基、(ix)
(x) モノー低級アルキルアミノ基、(xi) ジー低級アルキルア
5 ミノ基、(xii) 炭素原子と1個の窒素原子以外に窒素原子、酸素原子及び硫黄
原子から選ばれるヘテロ原子を1ないし3個有していてもよい5ないし7員環
状アミノ基、(xiii) 低級アルキルカルボニルアミノ基、(xiv) 低級アルキ
ルスルホニルアミノ基、(xv) 低級アルコキシカルボニル基、(xvi) カルボ
キシ基、(xvii) 低級アルキルカルボニル基、(xviii) カルバモイル基、チ
10 オカルバモイル基、(xix) モノー低級アルキルカルバモイル基、(xx) ジー
低級アルキルカルバモイル基、(xxi) 低級アルキルスルホニル基、(xxii)
(xxiii) 低級アルコキシカルボニル低級アルキル基、(xxiv) (1)ハロゲン原子、(2)ニトロ基、(3)シアノ基、(4)オキ
ソ基、(5)ヒドロキシ基、(6)低級アルキル基、(7)低級アルコキシ基、(8)低級
15 アルキルチオ基、(9)アミノ基、(10)モノー低級アルキルアミノ基、(11)ジ
低級アルキルアミノ基、(12)炭素原子と1個の窒素原子以外に窒素原子、酸素原
子及び硫黄原子から選ばれるヘテロ原子を1ないし3個有していてもよい5な
いし7員環状アミノ基、(13)低級アルキルカルボニルアミノ基、(14)低級ア
ルキルスルホニルアミノ基、(15)低級アルコキシカルボニル基、(16)カルボ
20 キシ基、(17)低級アルキルカルボニル基、(18)カルバモイル基、チオカルバ
モイル基、(19)モノー低級アルキルカルバモイル基、(20)ジ低級アルキル
カルバモイル基及び(21)低級アルキルスルホニル基から選ばれる1ないし5
個の置換基を有していてもよい窒素原子、酸素原子及び硫黄原子から選ばれる
ヘテロ原子を1ないし6個含む5ないし14員複素環から水素原子を1個除去
25 してできる基、(xxv) C_{6-14} アリール基、(xxvi) C_{7-16} アラルキル基、(xxvii) ウレイド基、3-メチルウレイド基、3-エチルウレイド基、3-フェ
ニルウレイド基、3-(4-フルオロフェニル)ウレイド基、3-(2-メチ
ルフェニル)ウレイド基、3-(4-メトキシフェニル)ウレイド基、3-(
2, 4-ジフルオロフェニル)ウレイド基、3-[3, 5-ビス(トリフルオ
30 ロメチル)フェニル]ウレイド基、3-ベンジルウレイド基、3-(1-ナフ

チル) ウレイド基又は3-(2-ピフェニル) ウレイド基、(xxviii) チオ
ウレイド基、3-メチルチオウレイド基、3-エチルチオウレイド基、3-フ
ェニルチオウレイド基、3-(4-フルオロフェニル) チオウレイド基、3-
(4-メチルフェニル) チオウレイド基、3-(4-メトキシフェニル) チオ
5 ウレイド基、3-(2, 4-ジクロロフェニル) チオウレイド基、3-ベンジ
ルチオウレイド基又は3-(1-ナフチル) チオウレイド基、(xxix) アミジ
ノ基、 N^1 -メチルアミジノ基、 N^1 -エチルアミジノ基、 N^1 -フェニルアミ
ジノ基、 N^1 , N^1 -ジメチルアミジノ基、 N^1 , N^2 -ジメチルアミジノ基、 N^1 -
 N^1 -メチル- N^1 -エチルアミジノ基、 N^1 , N^1 -ジエチルアミジノ基、 N^1 -
10 メチル- N^1 -フェニルアミジノ基又は N^1 , N^1 -ジ(4-ニトロフェニル)
アミジノ基、(xxx) グアニジノ基、3-メチルグアニジノ基、3, 3-ジメチ
ルグアニジノ基、3, 3-ジエチルグアニジノ基、(xxxi) ピロリジノカルボ
ニル基、ピペリジノカルボニル基、(4-メチルピペリジノ)カルボニル基、(4-
フェニルピペリジノ)カルボニル基、(4-ベンジルピペリジノ)カルボ
15 ニル基、(4-ベンゾイルピペリジノ)カルボニル基、[4-(4-フルオロ
ベンゾイル)ピペリジノ]カルボニル基、(4-メチルピペラジノ)カルボ
ニル基、(4-フェニルピペラジノ)カルボニル基、[4-(4-ニトロフェニ
ル)ピペラジノ]カルボニル基、(4-ベンジルピペラジノ)カルボニル基、
モルホリノカルボニル基又はチオモルホリノカルボニル基、(xxxii) アミノチ
20 オカルボニル基、メチルアミノチオカルボニル基、ジメチルアミノチオカルボ
ニル基、(xxxiii) アミノスルホニル基、メチルアミノスルホニル基又はジメ
チルアミノスルホニル基、(xxxiv) フェニルスルホニルアミノ基、(4-メチ
ルフェニル)スルホニルアミノ基、(4-クロロフェニル)スルホニルアミノ
基、(2, 5-ジクロロフェニル)スルホニルアミノ基、(4-メトキシフェ
25 ニル)スルホニルアミノ基、(4-アセチルアミノフェニル)スルホニルアミ
ノ基又は(4-ニトロフェニル)フェニルスルホニルアミノ基、(xxxv) スル
ホ基、(xxxvi) スルフィノ基、(xxxvii) スルフェノ基、(xxxviii) 低級アル
キルスルホ基、(xxxix) 低級アルキルスルフィノ基、(xxxx) 低級アルキル
スルフェノ基、(xxxxi) ホスホノ基及び(xxxxii) ジー低級アルコキシホスホ
30 リル基から選ばれる置換基を1ないし5個有していてもよいアルキル基、アル

- ケニル基、アルキニル基、シクロアルキル基、架橋環式低級飽和炭化水素基、アリール基、アラルキル基、アリールーアルケニル基、アリールーC₂₋₁₂アルキニル基、シクロアルキルーアルキル基又はアリールーアリールーC₁₋₁₀アルキル基、又は(4)(1)ハロゲン原子、(2)ニトロ基、(3)シアノ基、(4)オキソ
- 5 基、(5)ヒドロキシ基、(6)低級アルキル基、(7)低級アルコキシ基、(8)低級アルキルチオ基、(9)アミノ基、(10)モノー低級アルキルアミノ基、(11)ジー低級アルキルアミノ基、(12)炭素原子と1個の窒素原子以外に窒素原子、酸素原子及び硫黄原子から選ばれるヘテロ原子を1ないし3個有していてもよい5ないし7員環状アミノ基、(13)低級アルキルーカルボニルアミノ基、(14)低級アル
- 10 キルスルホニルアミノ基、(15)低級アルコキシカルボニル基、(16)カルボキシ基、(17)低級アルキルーカルボニル基、(18)カルバモイル基、チオカルバモイル基、(19)モノー低級アルキルーカルバモイル基、(20)ジー低級アルキルーカルバモイル基及び(21)低級アルキルスルホニル基から選ばれる置換基を1ないし5個有していてもよい窒素原子、酸素原子及び硫黄原子から選ばれるヘテ
- 15 ロ原子を1ないし6個含む5ないし14員複素環から水素原子を1個除去してできる基である請求項12記載の剤。

14. Arが式

151

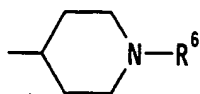


- で表される基で、Arがフェニル基の場合は、該フェニル基が①ハロゲン、②C₁₋₆アルコキシ、③アミノ、④モノ又はジC₁₋₆アルキルアミノ、⑤ピロリジノ、⑥ピペリジノ、⑦ピペラジノ、⑧N-メチルピペラジノ、⑨N-アセチル
- 5 ピペラジノ、⑩モルホリノ、⑪ヘキサメチレンイミノ、⑫イミダゾリル及び⑬C₁₋₆アルキルでエステル化されていてもよいカルボキシで置換されていてもよいC₁₋₆アルキルから選ばれる置換基を有していてもよく、Arが縮合したフェニル基の場合は、その複素環部分が①C₁₋₆アルキル、②ハロゲン、C₁₋₆アルキル、C₁₋₆アルコキシ及びニトロから選ばれる置換基を有していてもよい
- 10 C₇₋₁₆アラルキル、③C₁₋₆アルキル-カルボニル、④C₇₋₁₆アラルキル-カルボニル、⑤C₆₋₁₄アリール-カルボニル、⑥C₁₋₆アルキル-カルボニル-C₆₋₁₄アリール、⑦C₁₋₆アルコキシ-カルボニル-C₆₋₁₄アリール及び⑧ピリジルから選ばれる置換基を有していてもよく；

nが2；

- 15 Rが水素原子；及び

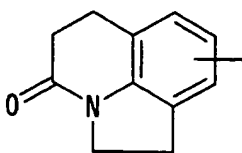
Yが式



で表される基

- (R^6 が①水素原子、②シアノ、ヒドロキシ、モノ又はジ C_{1-6} アルキルアミノ、ピリジル及びエステル化されていてもよいカルボキシから選ばれる置換基を有していてもよい C_{1-6} アルキル、③ハロゲン、 C_{1-6} アルキル、ハロゲン C_{1-6} アルキル、ヒドロキシ、 C_{1-6} アルコキシ、ニトロ、アミノ、シアノ、カルバモイル、エステル化されていてもよいカルボキシで置換されていてもよい C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} アルキルで置換されていてもよいカルバモイル又はホルミルで置換されていてもよいアミノ及び C_{1-3} アルキレンジオキシから選ばれる置換基を有していてもよい C_{7-16} アラルキル、④エステル化されていてもよいカルボキシで置換されていてもよい C_{1-6} アルキル又は⑤モノ又はジ C_{1-6} アルキルアミノで置換されていてもよい C_{1-6} アルキル-カルボニル) ;
- である請求項2記載の剤。

15. Arが式

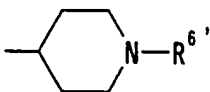


で表される基 ;

nが2 ;

Rが水素原子 ; 及び

Yが式



[式中、 $R^{6'}$ はハロゲン原子、 C_{1-3} アルキル基、 C_{1-3} アルコキシ基、シアノ基、ニトロ基及びヒドロキシ基から選ばれる置換基を1ないし2個有していてもよいベンジル基を示す。] で表される基である請求項2記載の剤。

16. 8-[3-[1-[(3-フルオロフェニル)メチル]-4-ピペリジン]
- 25 ニル]-1-オキソプロピル]-1,2,5,6-テトラヒドロ-4H-ピロロ[

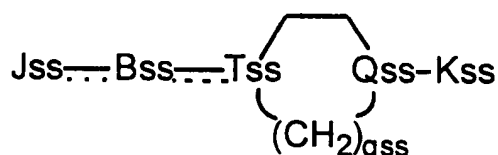
3, 2, 1-*ij*] キノリン-4-オン、

8-[3-[1-(フェニルメチル)-4-ピペリジニル]-1-オキソプロピル]-1, 2, 5, 6-テトラヒドロ-4H-ピロロ[3, 2, 1-*ij*]キノリン-4-オン、

- 5 8-[3-[1-[(2-ヒドロキシフェニル) メチル]-4-ピペリジニル]-1-オキソプロピル]-1, 2, 5, 6-テトラヒドロ-4H-ピロロ[3, 2, 1-*ij*]キノリン-4-オン又はその塩を含有してなる請求項1記載の剤。

17. アミン化合物が、式

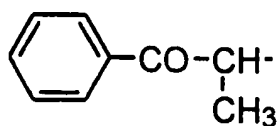
10



- 〔式中、Jssは(a)置換若しくは無置換の次に示す基；(1)フェニル基、(2)ピリジル基、(3)ピラジル基、(4)キノリル基、(5)シクロヘキシル基、(6)キノキサリル基又は(7)フリル基、

- (b)フェニル基が置換されていてもよい次の群から選択された一価又は二価の基；(1)インダニル、(2)インダノニル、(3)インデニル、(4)インデノニル、(5)インダンジオニル、(6)テトラロニル、(7)ベンズスベロニル、(8)インダノリル、(9)式

20



で示される基、

- (c) 環状アミド化合物から誘導される一価の基、
- 25 (d) 低級アルキル基、又は
- (e) 式 $\text{R}_{1\text{ss}} - \text{CH} = \text{CH} -$ (式中、 $\text{R}_{1\text{ss}}$ は水素原子又は低級アルコキシカ

ルボニル基を意味する) で示される基を意味する。

B_{ss} は式 $-(\text{CHR}_{2ss})_{nss}-$ で示される基、式 $-\text{CO}-(\text{CHR}_{2ss})_{nss}-$ で示される基、式 $-\text{NR}_{3ss}-(\text{CHR}_{2ss})_{nss}-$ (式中、 R_{3ss} は水素原子、低級アルキル基、アシル基、低級アルキルスルホニル基、置換されていて
5 もよいフェニル基又はベンジル基を意味する) で示される基、式 $-\text{CO}-\text{NR}_{4ss}-(\text{CHR}_{2ss})_{nss}-$ (式中、 R_{4ss} は水素原子、低級アルキル基又はフェニル基を意味する) で示される基、式 $-\text{CH}=\text{CH}-(\text{CHR}_{2ss})_{nss}-$ で示される基、式 $-\text{O}-\text{COO}-(\text{CHR}_{2ss})_{nss}-$ で示される基、式 $-\text{O}-\text{CO}-\text{NH}-(\text{CHR}_{2ss})_{nss}-$ で示される基、式 $-\text{NH}-\text{CO}-(\text{CHR}_{2ss})_{nss}-$ で示される基、式 $-\text{CH}_2-\text{CO}-\text{NH}-(\text{CHR}_{2ss})_{nss}-$ で示される基、式 $-(\text{CH}_2)_2-\text{CO}-\text{NH}-(\text{CHR}_{2ss})_{nss}-$ で示される基、式 $-\text{C}(\text{OH})\text{H}-(\text{CHR}_{2ss})_{nss}-$ で示される基 (以上の式中、 n_{ss} は0又は1
10 ~ 10 の整数を意味する。 R_{2ss} は式 $-(\text{CHR}_{2ss})_{nss}-$ で示されるアルキレン基が置換基を持たないか、又は1つ又は1つ以上のメチル基を有しているような形で水素原子又はメチル基を意味する)、式 $=(\text{CH}-\text{CH}=\text{CH})_{bss}-$ (式中、 b_{ss} は1 \sim 3の整数を意味する) で示される基、式 $=\text{CH}-(\text{CH}_2)_{css}-$ (式中、 c_{ss} は0又は1 \sim 9の整数を意味する) で示される基、式 $=(\text{CH}-\text{CH})_{dss}=$ (式中、 d_{ss} は0又は1 \sim 5の整数を意味する) で示される基、式 $-\text{CO}-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}_2-$ で示される基、式 $-\text{CO}-\text{CH}_2-\text{C}(\text{OH})\text{H}-\text{CH}_2-$ で示される基、式 $-\text{C}(\text{CH}_3)\text{H}-\text{CO}-\text{NH}-\text{CH}_2-$ で示される基、式 $-\text{CH}=\text{CH}-\text{CO}-\text{NH}-(\text{CH}_2)_2-$ で示される基、式 $-\text{NH}-$ で示される基、式 $-\text{O}-$ で示される基、式 $-\text{S}-$ で示される基、ジアルキルアミノアルキルカルボニル基又は低級アルコキシカルボニル基を意味する。

25 T_{ss} は窒素原子又は炭素原子を意味する。

Q_{ss} は窒素原子、炭素原子又は式 $>\text{N}\rightarrow\text{O}$ で示される基を意味する。

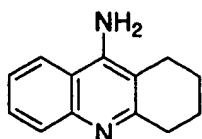
K_{ss} は水素原子、置換若しくは無置換のフェニル基、フェニル基が置換されてもよいアリールアルキル基、フェニル基が置換されていてもよいシンナミル基、低級アルキル基、ピリジルメチル基、シクロアルキルアルキル基、アダマ
30 ンタンメチル基、フリルメチル基、シクロアルキル基、低級アルコキシカルボ

ニル基又はアシル基を意味する。

q ss は 1 ～ 3 の整数を意味する。

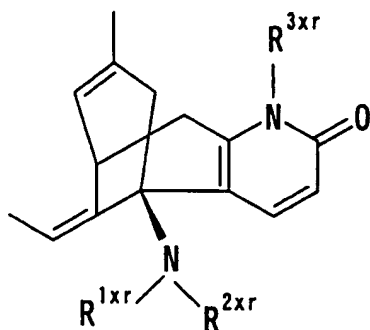
式中、--- は単結合若しくは二重結合を意味する。] で表される化合物又はその塩である請求項 1 記載の剤。

5 18. アミン化合物が、式



で表される 9-アミノ-1,2,3,4-テトラヒドロアクリジン又はその塩である請求項 1 記載の剤。

19. アミン化合物が式

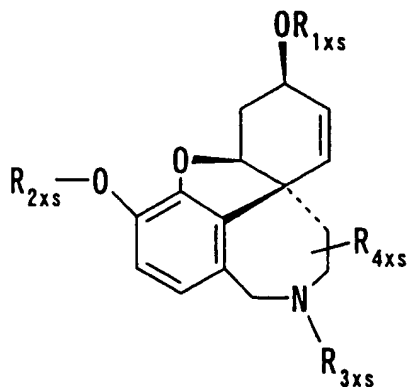


10

[式中、 R^{1xr} 、 R^{2xr} 及び R^{3xr} はそれぞれ水素原子又は低級アルキル基を示す。

] で表される化合物又はその塩である請求項 1 記載の剤。

20. アミン化合物が式



15

[式中、 R_{1xs} 及び R_{2xs} は同一のもの若しくは異なるものであり、それぞれ水素

原子、アシル基又は直鎖あるいは枝分かれしたアルキル基である。

R_{3xs} は直鎖又は枝分かれしたアルキル基、アルケニル基あるいはアルカリル基であり、これらの基は任意にハロゲン原子、あるいはシクロアルキル基、水酸基、アルコキシ基、ニトロ基、アミノ基、アミノアルキル基、アシルアミノ基、ヘテロアリール基、ヘテロアリール-アルキル基、アロイル基、アロイルアルキル基、あるいはシアノ基により置き換えられる。

R_{4xs} は四つの環状骨格を形成している炭素の少なくとも一つに結合している水素原子あるいはハロゲン原子を意味する。) で表されるガラントミン又はその塩である請求項 1 記載の剤。

- 10 2 1. 排尿障害治療剤である請求項 1 記載の剤。
- 2 2. 排尿困難治療剤である請求項 1 記載の剤。
- 2 3. アセチルコリンエステラーゼ阻害作用を有する非カルバメート系アミン化合物と α -遮断薬とを組合わせることを特徴とする膀胱排出力改善剤。
- 2 4. 膀胱排出力改善剤を製造するためのアセチルコリンエステラーゼ阻害作用を有する非カルバメート系アミン化合物の使用。
- 15 2 5. アセチルコリンエステラーゼ阻害作用を有する非カルバメート系アミン化合物を投与することを特徴とする膀胱排出力を改善する方法。

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP99/05367

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

Int.Cl.⁷ A61K31/13, 31/445, 31/454, 31/4709, 31/55, 31/553, 31/4523, 31/4525, 31/4535, 31/473, 31/437, C07D211/32, 401/06, 413/06, 405/06, 409/06, 471/06, 219/10, 221/18, 491/107, A61P13/00

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

Int.Cl.⁷ A61K31/13, 31/445, 31/454, 31/4709, 31/55, 31/553, 31/4523, 31/4525, 31/4535, 31/473, 31/437, C07D211/32, 401/06, 413/06, 405/06, 409/06, 471/06, 219/10, 221/18, 491/107, A61P13/00

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)

CA (STN), REGISTRY (STN)

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X Y	JP, 8-245582, A (KYORIN PHARMACEUTICAL Co., Ltd.), 24 September, 1996 (24.09.96), Claims 5, 6 (Family: none)	1, 21, 22, 24 2-20, 23
X Y	JP, 8-245583, A (KYORIN PHARMACEUTICAL Co., Ltd.), 24 September, 1996 (24.09.96), Claims 5, 6 (Family: none)	1, 21, 22, 24 2-20, 23
Y	EP, 607864, A2 (TAKEDA CHEMICAL INDUSTRIES, LTD), 27 July, 1994 (27.07.94) & JP, 7-206854, A & AU, 9453861, A & NO, 9400163, A & CA, 2113603, A & HU, 66182, A & FI, 9400229, A & TW, 248556, A & ZA, 9400203, A & NZ, 250682, A & US, 5527800, A & CN, 1104211, A & US, 5686466, A	2-16

☒ Further documents are listed in the continuation of Box C.

☐ See patent family annex.

* Special categories of cited documents:

"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance

"E" earlier document but published on or after the international filing date

"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)

"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means

"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention

"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone

"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art

"&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search
22 December, 1999 (22.12.99)

Date of mailing of the international search report
11 January, 2000 (11.01.00)

Name and mailing address of the ISA/
Japanese Patent Office

Authorized officer

Facsimile No.

Telephone No.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP99/05367

C (Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
Y	EP, 296560, A1 (Eisai Co., Ltd), 28 December, 1988 (28.12.88) & JP, 1-79151, A & AU, 8818216, A & NO, 8802696, A & DK, 8803379, A & FI, 8802716, A & ZA, 8804338, A & CN, 1030752, A & US, 4895841, A	17
Y	EP, 500006, A1 (HOECHST-ROUSSEL PHARMACEUTICALS INCORPORATED), 26 August, 1992 (26.08.92) & JP, 4-346975, A & AU, 9211073, A & NO, 9200636, A & US, 5155226, A & CA, 2061422, A & BR, 9200524, A & FI, 9200675, A & ZA, 9201160, A	18
Y	US, 5177082, A (Chao-mei Yu), 05 January, 1993 (05.01.93) (Family: none)	19
Y	WO, 92/20327, A1 (SNORRASON), 26 November, 1992 (26.11.92) & JP, 6-507617, A & AU, 9218736, A & NO, 9304103, A & EP, 584285, A1	20
Y	JP, 9-20755, A (HOKURIKU SEIYAKU CO., LTD.), 21 January, 1997 (21.01.97) (Family: none)	23

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP99/05367**Box I Observations where certain claims were found unsearchable (Continuation of Item 1 of first sheet)**

This international search report has not been established in respect of certain claims under Article 17(2)(a) for the following reasons:

1. ☒ Claims Nos.: 25
because they relate to subject matter not required to be searched by this Authority, namely:

The subject matter of claim 25 relates to a method for treatment of the human body or animal by therapy ,
which does not require an international search report by this International Search Authority .
2. ☐ Claims Nos.:
because they relate to parts of the international application that do not comply with the prescribed requirements to such an
extent that no meaningful international search can be carried out, specifically:
3. ☐ Claims Nos.:
because they are dependent claims and are not drafted in accordance with the second and third sentences of Rule 6.4(a).

Box II Observations where unity of invention is lacking (Continuation of Item 2 of first sheet)

This International Searching Authority found multiple inventions in this international application, as follows:

1. ☐ As all required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers all searchable
claims.
2. ☐ As all searchable claims could be searched without effort justifying an additional fee, this Authority did not invite payment
of any additional fee.
3. ☐ As only some of the required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers
only those claims for which fees were paid, specifically claims Nos.:
4. ☐ No required additional search fees were timely paid by the applicant. Consequently, this international
search report is restricted to the invention first mentioned in the claims; it is covered by claims Nos.:

Remark on Protest ☐ The additional search fees were accompanied by the applicant's protest.
☐ No protest accompanied the payment of additional search fees.

国際調査報告

国際出願番号 PCT/JP99/05367

A. 発明の属する分野の分類 (国際特許分類 (IPC))

Int. Cl⁷ A61K31/13, 31/445, 31/454, 31/4709, 31/55, 31/553,
31/4523, 31/4525, 31/4535, 31/473, 31/437, C07D211/32, 401/
06, 413/06, 405/06, 409/06, 471/06, 219/10, 221/18, 491/107,

B. 調査を行った分野

調査を行った最小限資料 (国際特許分類 (IPC))

Int. Cl⁷ A61K31/13, 31/445, 31/454, 31/4709, 31/55, 31/553,
31/4523, 31/4525, 31/4535, 31/473, 31/437, C07D211/32, 401/
06, 413/06, 405/06, 409/06, 471/06, 219/10, 221/18, 491/107,

最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの

国際調査で使用了電子データベース (データベースの名称、調査に使用した用語)
CA (STN), REGISTRY (STN)

C. 関連すると認められる文献

引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
X Y	JP, 8-245582, A (杏林製薬株式会社) 24. 9月. 1996 (24. 09. 96) (特に請求項5, 6) (ファミリーなし)	1, 21, 22, 24 2-20, 23
X Y	JP, 8-245583, A (杏林製薬株式会社) 24. 9. 1996 (24. 09. 96) (特に請求項5, 6) (ファミリーなし)	1, 21, 22, 24 2-20, 23
Y	EP, 607864, A2 (TAKEDA CHEMICAL INDUSTRIES, LTD) 27. 7月. 1994 (27. 07. 94) & JP, 7-206854, A & AU, 9453861, A & NO, 9400163, A & CA, 2113603, A	2-16

☒ C欄の続きにも文献が列挙されている。

☐ パテントファミリーに関する別紙を参照。

* 引用文献のカテゴリー

「A」特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの

「E」国際出願日前の出願または特許であるが、国際出願日以後に公表されたもの

「L」優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献 (理由を付す)

「O」口頭による開示、使用、展示等に言及する文献

「P」国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願

の日の後に公表された文献

「T」国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と矛盾するものではなく、発明の原理又は理論の理解のために引用するもの

「X」特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規性又は進歩性がないと考えられるもの

「Y」特に関連のある文献であって、当該文献と他の1以上の文献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性がないと考えられるもの

「&」同一パテントファミリー文献

国際調査を完了した日

22. 12. 99

国際調査報告の発送日

11.01.00

国際調査機関の名称及びあて先

日本国特許庁 (ISA/JP)

郵便番号100-8915

東京都千代田区霞が関三丁目4番3号

特許庁審査官 (権限のある職員)

今村 玲 英 子

4C

8517

電話番号 03-3581-1101 内線 3452

C (続き) . 関連すると認められる文献		
引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
	& HU, 66182, A & FI, 9400229, A & TW, 248556, A & ZA, 9400203, A & NZ, 250682, A & US, 5527800, A & CN, 1104211, A & US, 5686466, A	
Y	EP, 296560, A1 (Eisai Co., Ltd) 28. 12月. 1988 (28. 12. 88) & JP, 1-79151, A & AU, 8818216, A & NO, 8802696, A & DK, 8803379, A & FI, 8802716, A & ZA, 8804338, A & CN, 1030752, A & US, 4895841, A	17
Y	EP, 500006, A1 (HOECHST-ROUSSEL PHARMACEUTICALS INCORPORATED) 26. 8月. 1992 (26. 08. 92) & JP, 4-346975, A & AU, 9211073, A & NO, 9200636, A & US, 5155226, A & CA, 2061422, A & BR, 9200524, A & FI, 9200675, A & ZA, 9201160, A	18
Y	US, 5177082, A (Chao-mei Yu) 05. 1月. 1993 (05. 01. 93) (ファミリーなし)	19
Y	WO, 92/20327, A1 (SNORRASON) 26. 11月. 1992 (26. 11. 92) & JP, 6-507617, A & AU, 9218736, A & NO, 9304103, A & EP, 584285, A1	20
Y	JP, 9-20755, A (北陸製薬株式会社) 21. 1月. 1997 (21. 01. 97) (ファミリーなし)	23

第Ⅰ欄 請求の範囲の一部の調査ができないときの意見 (第1ページの2の続き)

法第8条第3項 (PCT 17条(2)(a)) の規定により、この国際調査報告は次の理由により請求の範囲の一部について作成しなかった。

1. ☒ 請求の範囲 25 は、この国際調査機関が調査をすることを要しない対象に係るものである。
つまり、
治療による人体又は動物の体の処置方法に関するものであって、国際調査機関が国際調査することを要しない対象にあたる。
2. ☐ 請求の範囲 _____ は、有意義な国際調査をすることができる程度まで所定の要件を満たしていない国際出願の部分に係るものである。つまり、
3. ☐ 請求の範囲 _____ は、従属請求の範囲であってPCT規則6.4(a)の第2文及び第3文の規定に従って記載されていない。

第Ⅱ欄 発明の単一性が欠如しているときの意見 (第1ページの3の続き)

次に述べるようにこの国際出願に二以上の発明があるところの国際調査機関は認めた。

1. ☐ 出願人が必要な追加調査手数料をすべて期間内に納付したので、この国際調査報告は、すべての調査可能な請求の範囲について作成した。
2. ☐ 追加調査手数料を要求するまでもなく、すべての調査可能な請求の範囲について調査することができたので、追加調査手数料の納付を求めなかった。
3. ☐ 出願人が必要な追加調査手数料を一部のみしか期間内に納付しなかったので、この国際調査報告は、手数料の納付のあった次の請求の範囲のみについて作成した。
4. ☐ 出願人が必要な追加調査手数料を期間内に納付しなかったので、この国際調査報告は、請求の範囲の最初に記載されている発明に係る次の請求の範囲について作成した。

追加調査手数料の異議の申立てに関する注意

- ☐ 追加調査手数料の納付と共に出願人から異議申立てがあった。
☐ 追加調査手数料の納付と共に出願人から異議申立てがなかった。

A. 発明の属する分野の分類（国際特許分類（IPC））の続き
A 61 P 13 / 00

B. 調査を行った分野 調査を行った最小限資料（国際特許分類（IPC））の続き
A 61 P 13 / 00